

参考例 2 で製造した樹脂 (3) (0.5 g)、N-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドン (0.396 g)、チオフェン-2-イルメチルアミン (0.205 ml) および N-(t-ブチルオキシカルボニル)ロイシン (0.542 g)、4-フェニルオキシベンゾアルデヒド (0.252 g) を用いて、実施例 23 と同様の操作を
 5 し、以下の物性値を有する本発明化合物 (274 mg) を得た。

TLC: R_f 0.39 (クロロホルム: メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (m, 2 H), 7.39 (m, 2 H), 7.28 (m, 1 H), 7.18 (m, 2 H),
 7.04 (m, 4 H), 6.91 (m, 1 H), 4.86 (s, 2 H), 4.32 (s, 2 H), 4.12 (dd, J = 8.1, 4.5 Hz,
 1 H), 3.77 (m, 2 H), 3.49 (m, 2 H), 2.60 - 2.30 (m, 2 H), 2.19 (m, 2 H), 1.98 (s, 3
 10 H), 1.97 - 1.58 (m, 3 H), 0.94 (d, J = 6.0 Hz, 6 H)。

実施例 23 (H22-1) ~ 23 (H31-31)

参考例 2 で製造した樹脂 (3)、相当する 4-ピペリドン誘導体、相当するアミン誘導体、相当するアミノ酸誘導体、および相当するアルデヒド誘導
 15 体を用いて、実施例 23 または 23 (1) と同様の操作をし、以下の表 22 A-1 ~ 31 A-4 に化合物名を示し、表 22 B-1 ~ 31 B-5 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 22 C-1 ~ 31 C-2 に示した。

表 22A-1

実施例番号	化合物名
23 (H22-1)	(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-2)	(3R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-3)	(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - メチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-4)	(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-5)	(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1 - (ベンジルオキシメチル) イミダゾール - 5 - イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-6)	(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (ベンジルオキシメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-7)	(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - メトキシフェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-8)	(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - (ベンジルオキシ) エチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 22A-2

実施例番号	化合物名
23 (H22-9)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-10)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ブチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-11)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (シクロヘキシルオキシカルボニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-12)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (シクロヘキシルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-13)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (シクロヘキシルオキシカルボニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-14)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - (シクロヘキシルオキシカルボニル) エチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-15)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシ) フェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-16)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ヒドロキシメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 22A-3

実施例番号	化合物名
23 (H22-17)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシ) フェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-18)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ブチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-19)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (シクロヘキシルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-20)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - (ベンジルオキシ) エチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-21)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (ベンジルオキシメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-22)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((4 - メトキシフェニルメチルチオ) メチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-23)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (ベンジルチオメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-24)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 22A-4

実施例番号	化合物名
23 (H22-25)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (イミダゾール - 4 - イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-26)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ヒドロキシメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-27)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((3 - ニトロピリジン - 2 - イル) ジスルファニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-28)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1 - ベンジルイミダゾール - 4 - イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-29)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - ヒドロキシフェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-30)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) フェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-31)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (アミノカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-32)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1 - ナフチルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 22A-5

実施例番号	化合物名
23 (H22-33)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3, 4 - ジクロロフェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-34)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1, 1 - ジメチルエチルチオ) メチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-35)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 4 - メチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-36)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - プロピル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-37)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - ベンジルオキシフェニルメチル) - 4 - メチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-38)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒドロキシエチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-39)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (アミノカルボニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-40)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒドロキシエチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-41)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - メチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 22A-6

実施例番号	化合物名
23 (H22-42)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (ピリジン - 3 - イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-43)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (カルボキシメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-44)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - ヒドロキシフェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-45)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルチオエチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-46)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((メチルカルボニルアミノ) メチルチオメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-47)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - ヒドロキシエチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-48)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - クロロフェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-49)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1 - ナフチルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-50)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - フルオロフェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 22A-7

実施例番号	化合物名
23 (H22-51)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (シアノメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-52)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-53)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (2 - クロロフェニルメチルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-54)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (ベンジルオキシカルボニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-55)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (1 - イミノ - 1 - (2, 4, 6 - トリメチルフェニルスルホニルアミノ) メチルアミノ) プロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-56)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (ベンジルオキシカルボニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-57)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-58)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - メトキシフェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 22A-8

実施例番号	化合物名
23 (H22-59)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-60)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-61)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1 - (ベンジルオキシメチル) イミダゾール - 4 - イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-62)	(3 R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - エトキシフェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-63)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - フェニルフェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H22-64)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1, 1 - ジフェニルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 23A-1

実施例番号	化合物名
23 (H23-1)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-2)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-3)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ジエチルアミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-4)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-5)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-6)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-7)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-アリルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-8)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ジベンゾフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-9)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 23A-2

実施例番号	化合物名
23 (H23-10)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-11)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-12)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-ジエチルアミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-13)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-14)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-15)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-16)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-アリルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-17)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(ジベンゾフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H23-18)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 24A-1

実施例番号	化合物名
23 (H24-1)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-2)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-3)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-4)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-プロモチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-5)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-6)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-7)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-8)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-9)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 24A-2

実施例番号	化合物名
23 (H24-10)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-11)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-12)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-13)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-14)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-15)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-16)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-17)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-18)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 24A-3

実施例番号	化合物名
23 (H24-19)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-20)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-21)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-22)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-プロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-23)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-24)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H24-25)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 24A-4

実施例番号	化合物名
23 (H24-26)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-27)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-28)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-29)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-30)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H24-31)	1-エチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 25A-1

実施例番号	化合物名
23 (H25-1)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-2)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-3)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-4)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-プロモチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-5)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-6)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-7)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-8)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 25A-2

実施例番号	化合物名
23 (H25-9)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-10)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-11)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-12)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-13)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-14)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-15)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H25-16)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 25A-3

実施例番号	化合物名
23 (H25-17)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-18)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-19)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-プロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-20)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-21)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-22)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-23)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 25A-4

実施例番号	化合物名
23 (H25-24)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-25)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-26)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-27)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H25-28)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 26A-1

実施例番号	化合物名
23 (H26-1)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-2)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-3)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-4)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-プロモチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-5)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-6)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-7)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-8)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-9)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 26A-2

実施例番号	化合物名
23 (H26-10)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-11)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-12)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-13)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-14)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-15)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-16)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-17)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-18)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 26A-3

実施例番号	化合物名
23 (H26-19)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-20)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-21)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-22)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-プロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-23)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-24)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H26-25)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 26A-4

実施例番号	化合物名
23 (H26-26)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-27)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-28)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-29)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-30)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H26-31)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 27A-1

実施例番号	化合物名
23 (H27-1)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-2)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メトキシフェニル)メチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-3)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-4)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-フェノキシフェニル)メチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-5)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ベンジルオキシフェニル)メチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-6)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-7)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-8)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ヒドロキシフェニル)メチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-9)	1-((2-メトキシフェニル)メチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-2

実施例番号	化合物名
23 (H27-10)	1 - ((2-メトキシフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウン デカン
23 (H27-11)	1 - ((2-メトキシフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオ キサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-12)	1 - ((2-メトキシフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェ ニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
23 (H27-13)	1 - ((2-メトキシフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシ フェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-14)	1 - ((2-メトキシフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチルー 1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9- トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-15)	1 - ((2-メトキシフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダ ゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-16)	1 - ((2-メトキシフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェ ニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン

表 27A-3

実施例番号	化合物名
23 (H27-17)	1 - ((3 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ベンジル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-18)	1 - ((3 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((4 - メトキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウン デカン
23 (H27-19)	1 - ((3 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((4 - フェノキシフェ ニル) メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
23 (H27-20)	1 - ((3 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((4 - ベンジルオキシ フェニル) メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-21)	1 - ((3 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチルー 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-22)	1 - ((3 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - フェニルイミダ ゾール - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-23)	1 - ((3 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((4 - ヒドロキシフェ ニル) メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン

表 27A-4

実施例番号	化合物名
23 (H27-24)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9-ベンジル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-25)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオ キサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-26)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェ ニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
23 (H27-27)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシ フェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-28)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル- 1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9- トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-29)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダ ゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-30)	1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェ ニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン

表 27A-5

実施例番号	化合物名
23 (H27-31)	1 - (ピリジン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9-ベンジル-1, 4, 9-ト リアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-32)	1 - (ピリジン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカ ン
23 (H27-33)	1 - (ピリジン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2H, 3H-ベンゾ [3, 4-e] 1, 4-ジオキサ-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-34)	1 - (ピリジン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカ ン
23 (H27-35)	1 - (ピリジン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフェ ニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
23 (H27-36)	1 - (ピリジン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1- フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリ アザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-37)	1 - (ピリジン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾ ール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-6

実施例番号	化合物名
23 (H27-38)	1 - (ピリジン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-39)	1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-40)	1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-メトキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-41)	1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-42)	1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-43)	1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-44)	1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-7

実施例番号	化合物名
23 (H27-45)	1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-46)	1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-47)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-48)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-メトキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-49)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-50)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-51)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-8

実施例番号	化合物名
23 (H27-52)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-53)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-54)	1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-55)	1 - ((2-メチルフェニル)メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ベンジル - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-56)	1 - ((2-メチルフェニル)メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-メトキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-57)	1 - ((2-メチルフェニル)メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-58)	1 - ((2-メチルフェニル)メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-9

実施例番号	化合物名
23 (H27-59)	1 - ((2-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフ ェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-60)	1 - ((2-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1 -フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-ト リアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-61)	1 - ((2-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾ ール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-62)	1 - ((2-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニ ル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウン デカン
23 (H27-63)	1 - ((3-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ベンジル-1, 4, 9- トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-64)	1 - ((3-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカ ン
23 (H27-65)	1 - ((3-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキ サン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-10

実施例番号	化合物名
23 (H27-66)	1 - ((3-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-67)	1 - ((3-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-68)	1 - ((3-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-69)	1 - ((3-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-70)	1 - ((3-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-71)	1 - ((4-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ベンジル - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-72)	1 - ((4-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-メトキシフェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 27A-11

実施例番号	化合物名
23 (H27-73)	1 - ((4-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキ サン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-74)	1 - ((4-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-フェノキシフェニ ル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウン デカン
23 (H27-75)	1 - ((4-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ベンジルオキシフ ェニル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-76)	1 - ((4-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1 -フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-ト リアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-77)	1 - ((4-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルイミダゾ ール-5-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H27-78)	1 - ((4-メチルフェニル)メチル) - 2, 5-ジオキソ- 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - ((4-ヒドロキシフェニ ル)メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウン デカン

表 28A-1

実施例番号	化合物名
23 (H28-1)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-2)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-3)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-4)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-プロモチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-5)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3-メチルチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-6)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-7)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-8)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-9)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 28A-2

実施例番号	化合物名
23 (H28-10)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-11)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-12)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-13)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-14)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-15)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-16)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-17)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 28A-3

実施例番号	化合物名
23 (H28-18)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-19)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-20)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-21)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-プロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-22)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-23)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H28-24)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 28A-4

実施例番号	化合物名
23 (H28-25)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-26)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-27)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-28)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-29)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H28-30)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 29A-1

実施例番号	化合物名
23 (H29-1)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-2)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-3)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-4)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-プロモチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-5)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3-メチルチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-6)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-7)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-8)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-9)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 29A-2

実施例番号	化合物名
23 (H29-10)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-11)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-12)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-13)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-14)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-15)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-16)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-17)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-18)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 29A-3

実施例番号	化合物名
23 (H29-19)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-20)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-21)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-22)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-プロモチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-23)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-24)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H29-25)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 29A-4

実施例番号	化合物名
23 (H29-26)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-27)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-28)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-29)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-30)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H29-31)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 30A-1

実施例番号	化合物名
23 (H30-1)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-2)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-3)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-4)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-プロモチオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-5)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3-メチルチオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-6)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-7)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-8)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 30A-2

実施例番号	化合物名
23 (H30-9)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-10)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2,4-ジオキソ-1,3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-11)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-12)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-13)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(インドール-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-14)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-15)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 30A-3

実施例番号	化合物名
23 (H30-16)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-17)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-エチルチオフエン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-18)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-19)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-20)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-21)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
23 (H30-22)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-プロモチオフエン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 30A-4

実施例番号	化合物名
23 (H30-23)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H30-24)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H30-25)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H30-26)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H30-27)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H30-28)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H30-29)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 30A-5

実施例番号	化合物名
23 (H30-30)	1 - (2 - メトキシエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2, 5 - ジメチル - 1 - (4 - カルボキシフェニル) ピロール - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H30-31)	1 - (2 - メトキシエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (5 - (4 - クロロフェニル) フラン - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 6] ウンデカン

表 31A-1

実施例番号	化合物名
23 (H31-1)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-2)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-3)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-メチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-4)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-ブromochioフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-5)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3-メチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-6)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-7)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(ピリジン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-8)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-メチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-9)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルイミダゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 31A-2

実施例番号	化合物名
23 (H31-10)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2, 4-ジオキソ-1, 3-ジヒドロピリミジン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-11)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-12)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-13)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-14)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-15)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(カルボキシ)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-16)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(カルボキシ)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-17)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-エチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-18)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-メチルベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

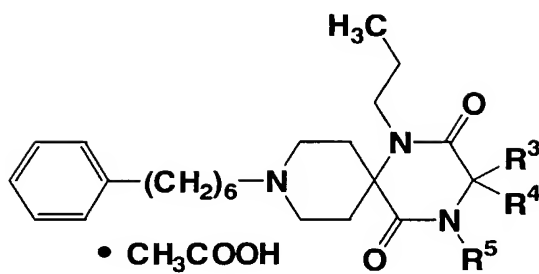
表 31A-3

実施例番号	化合物名
23 (H31-19)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-トリフルオロメトキシフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-20)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(6-(メトキシカルボニル)インドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-21)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-22)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-プロモチオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-23)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-24)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
23 (H31-25)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-アセチルインドール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 31A-4

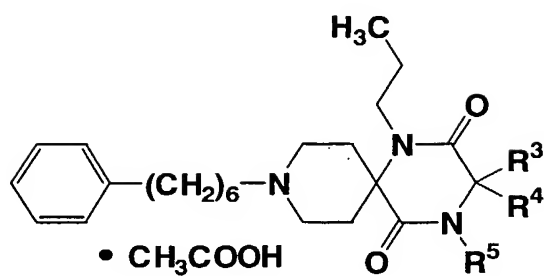
実施例番号	化合物名
23 (H31-26)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(3, 5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-27)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-クロロ-3-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-28)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(4-メトキシフェニル)チオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-29)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(2-トリフルオロメチルフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-30)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピロール-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
23 (H31-31)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 6]ウンデカン

表 22B-1



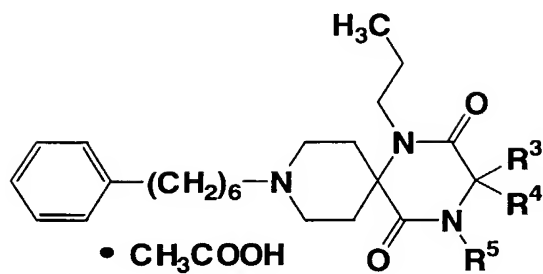
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-1)	H		H
23 (H22-2)	H		H
23 (H22-3)	H		H
23 (H22-4)	H		H
23 (H22-5)	H		H
23 (H22-6)	H		H
23 (H22-7)	H		H
23 (H22-8)	H		H

表 22B-2



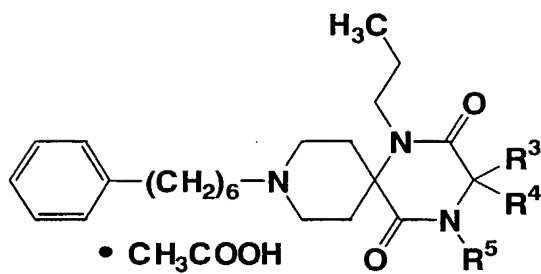
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-9)	H		H
23 (H22-10)	H		H
23 (H22-11)	H		H
23 (H22-12)	H		H
23 (H22-13)	H		H
23 (H22-14)	H		H
23 (H22-15)	H		H
23 (H22-16)	H		H

表 22B-3



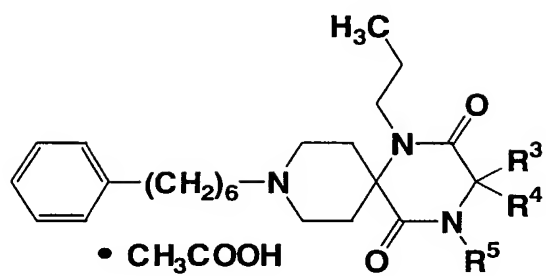
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-17)	H		H
23 (H22-18)	H		H
23 (H22-19)	H		H
23 (H22-20)	H		H
23 (H22-21)	H		H
23 (H22-22)	H		H
23 (H22-23)	H		H
23 (H22-24)	H	H	H

表 22B-4



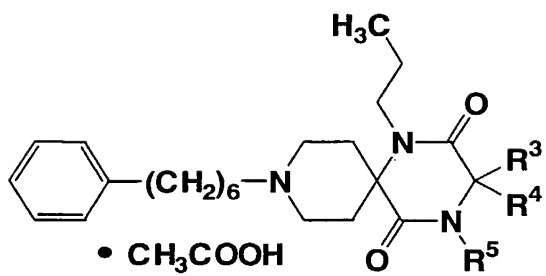
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-25)	H		H
23 (H22-26)	H		H
23 (H22-27)	H		H
23 (H22-28)	H		H
23 (H22-29)	H		H
23 (H22-30)	H		H
23 (H22-31)	H		H

表 22B-5



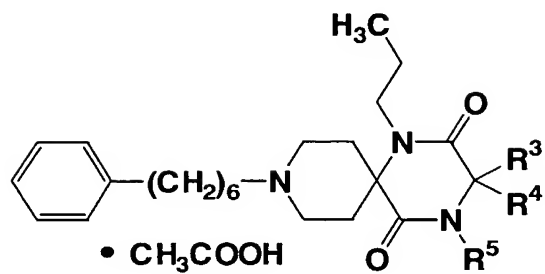
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-32)	H		H
23 (H22-33)	H		H
23 (H22-34)	H		H
23 (H22-35)	H		X ₅ —CH ₃
23 (H22-36)	H		H
23 (H22-37)	H		X ₅ —CH ₃
23 (H22-38)	H		H
23 (H22-39)	H		H

表 22B-6



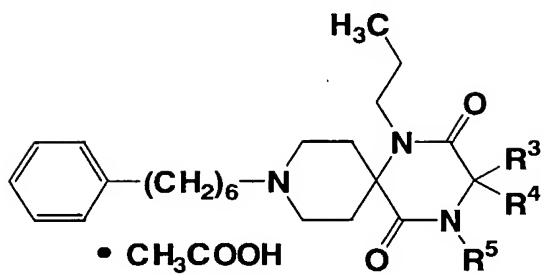
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-40)	H		H
23 (H22-41)	H		H
23 (H22-42)	H		H
23 (H22-43)	H		H
23 (H22-44)	H		H
23 (H22-45)	H		H
23 (H22-46)	H		H
23 (H22-47)	H		H
23 (H22-48)	H		H

表 22B-7



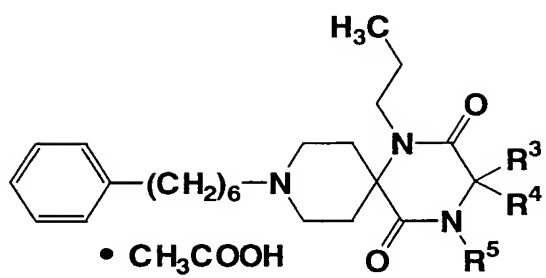
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-49)	H		H
23 (H22-50)	H		H
23 (H22-51)	H		H
23 (H22-52)	H		H
23 (H22-53)	H		H
23 (H22-54)	H		H
23 (H22-55)	H		H

表 22B-8



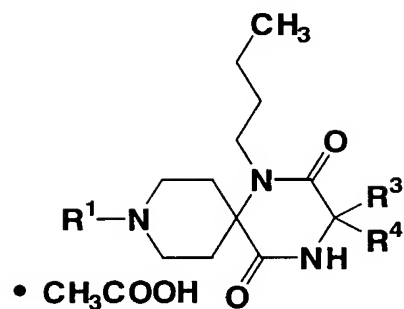
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-56)	H		H
23 (H22-57)	H		H
23 (H22-58)	H		H
23 (H22-59)	H		H
23 (H22-60)	H		H
23 (H22-61)	H		H

表 22B-9



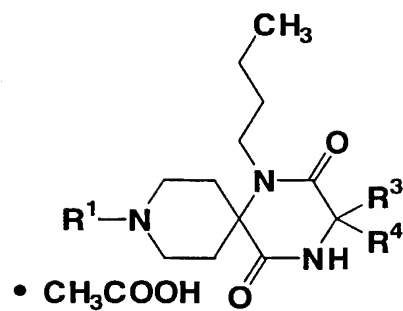
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
23 (H22-62)	H		H
23 (H22-63)	H		H
23 (H22-64)	H		H

表 23B-1



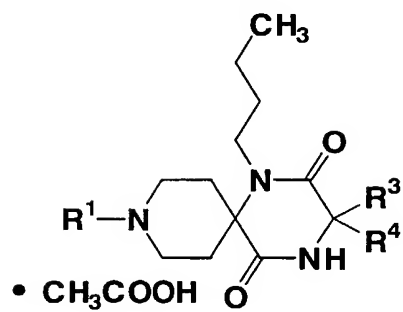
実施例番号	R ¹	R ³	R ⁴
23 (H23-1)		H	
23 (H23-2)		H	
23 (H23-3)		H	
23 (H23-4)		H	
23 (H23-5)		H	
23 (H23-6)		H	
23 (H23-7)		H	
23 (H23-8)		H	

表 23B-2



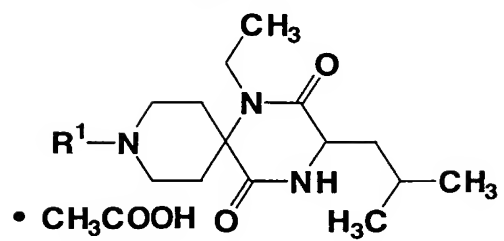
実施例番号	R ¹	R ³	R ⁴
23 (H23-9)		H	
23 (H23-10)		H	
23 (H23-11)		H	
23 (H23-12)		H	
23 (H23-13)		H	
23 (H23-14)		H	
23 (H23-15)		H	

表 23B-3



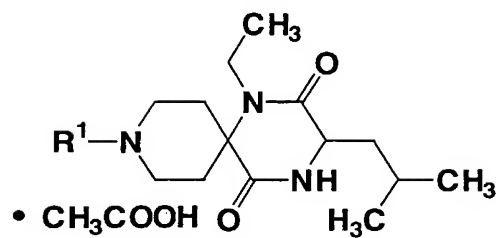
実施例番号	R ¹	R ³	R ⁴
23 (H23-16)		H	
23 (H23-17)		H	
23 (H23-18)		H	

表 24B-1



実施例番号	R ¹
23 (H24-1)	
23 (H24-2)	
23 (H24-3)	
23 (H24-4)	
23 (H24-5)	
23 (H24-6)	
23 (H24-7)	
23 (H24-8)	

表 24B-2



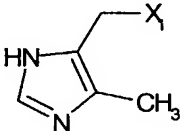
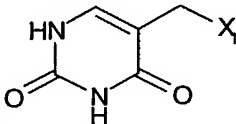
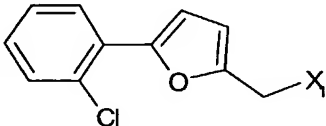
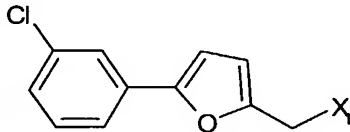
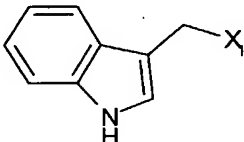
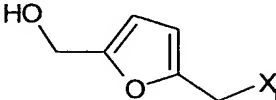
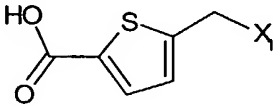
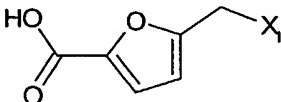
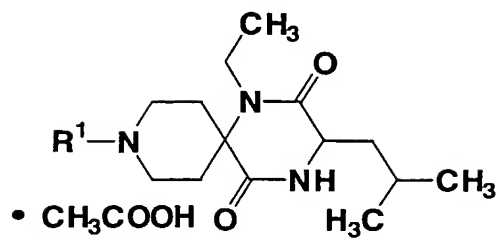
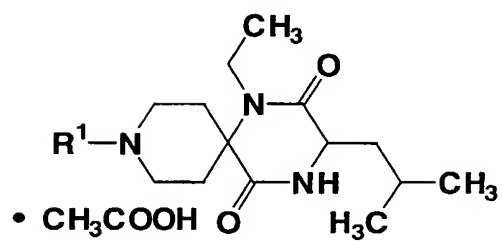
実施例番号	R ¹
23 (H24-9)	
23 (H24-10)	
23 (H24-11)	
23 (H24-12)	
23 (H24-13)	
23 (H24-14)	
23 (H24-15)	
23 (H24-16)	

表 24B-3



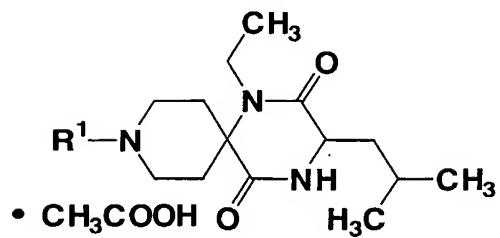
実施例番号	R ¹
23 (H24-17)	
23 (H24-18)	
23 (H24-19)	
23 (H24-20)	
23 (H24-21)	
23 (H24-22)	

表 24B-4



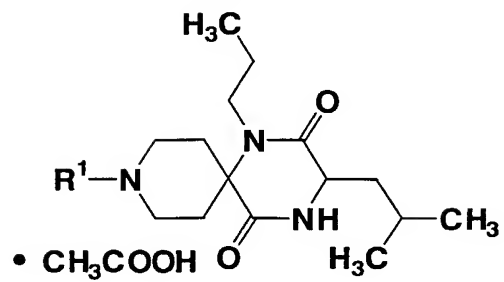
実施例番号	R ¹
23 (H24-23)	
23 (H24-24)	
23 (H24-25)	
23 (H24-26)	
23 (H24-27)	
23 (H24-28)	

表 24B-5



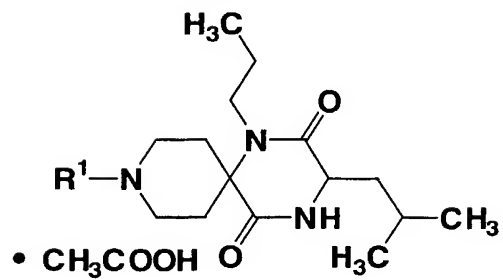
実施例番号	R ¹
23 (H24-29)	
23 (H24-30)	
23 (H24-31)	

表 25B-1



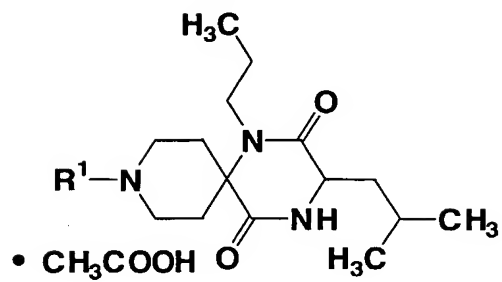
実施例番号	R ¹
23 (H25-1)	
23 (H25-2)	
23 (H25-3)	
23 (H25-4)	
23 (H25-5)	
23 (H25-6)	
23 (H25-7)	
23 (H25-8)	

表 25B-2



実施例番号	R ¹
23 (H25-9)	
23 (H25-10)	
23 (H25-11)	
23 (H25-12)	
23 (H25-13)	
23 (H25-14)	
23 (H25-15)	

表 25B-3



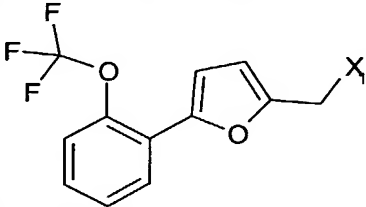
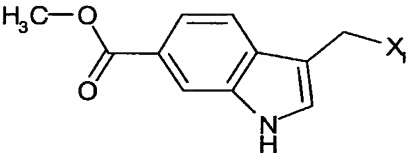
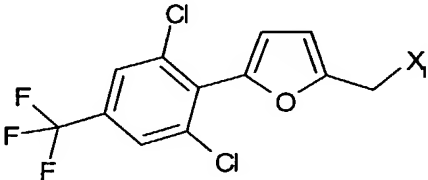
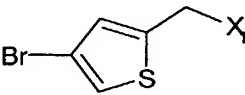
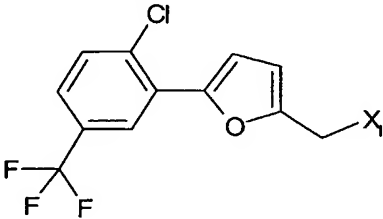
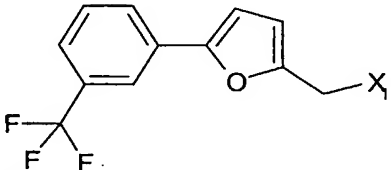
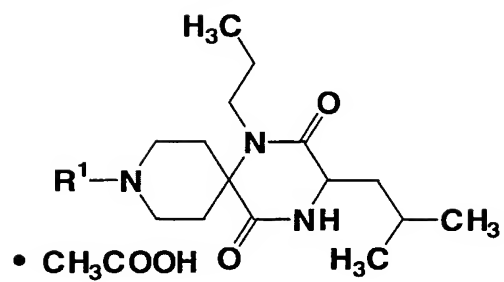
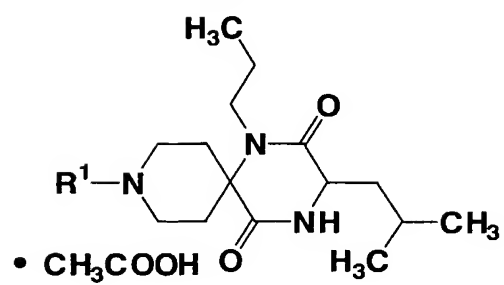
実施例番号	R ¹
23 (H25-16)	
23 (H25-17)	
23 (H25-18)	
23 (H25-19)	
23 (H25-20)	
23 (H25-21)	

表 25B-4



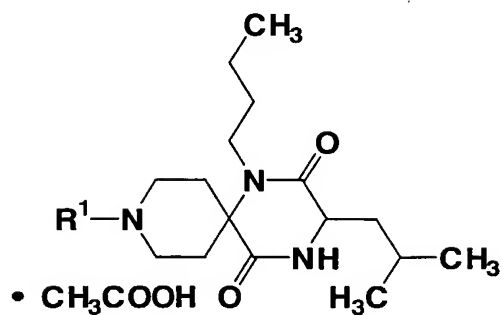
実施例番号	R ¹
23 (H25-22)	
23 (H25-23)	
23 (H25-24)	
23 (H25-25)	
23 (H25-26)	
23 (H25-27)	

表 25B-5



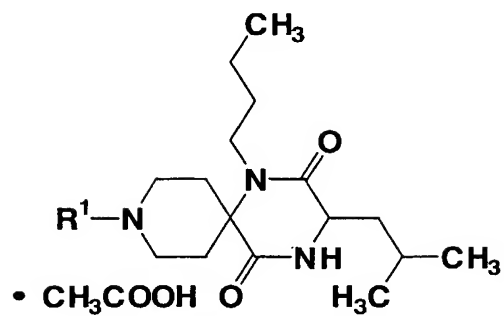
実施例番号	R ¹
23 (H25-28)	

表 26B-1



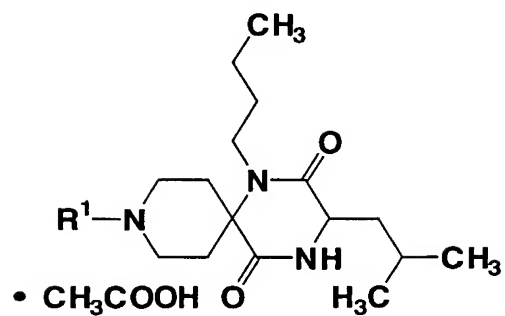
実施例番号	R ¹
23 (H26-1)	
23 (H26-2)	
23 (H26-3)	
23 (H26-4)	
23 (H26-5)	
23 (H26-6)	
23 (H26-7)	
23 (H26-8)	

表 26B-2



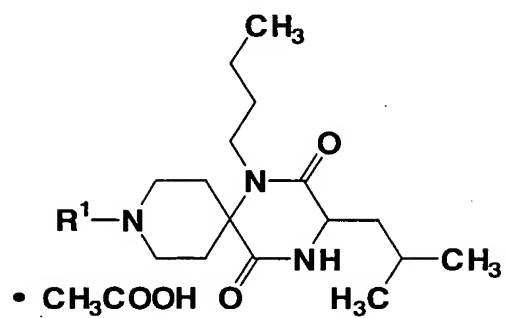
実施例番号	R ¹
23 (H26-9)	
23 (H26-10)	
23 (H26-11)	
23 (H26-12)	
23 (H26-13)	
23 (H26-14)	
23 (H26-15)	

表 26B-3



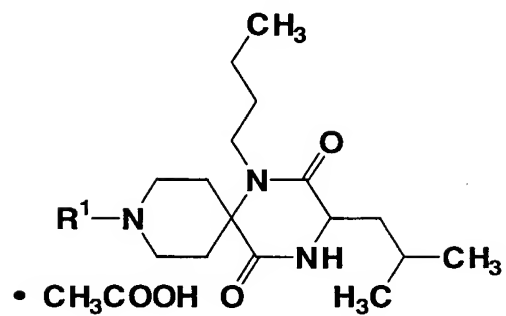
実施例番号	R ¹
23 (H26-16)	
23 (H26-17)	
23 (H26-18)	
23 (H26-19)	
23 (H26-20)	
23 (H26-21)	
23 (H26-22)	

表 26B-4



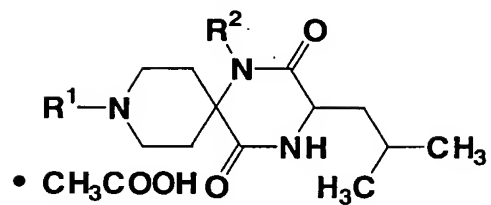
実施例番号	R ¹
23 (H26-23)	
23 (H26-24)	
23 (H26-25)	
23 (H26-26)	
23 (H26-27)	

表 26B-5



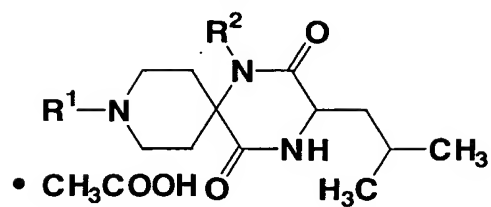
実施例番号	R ¹
23 (H26-28)	
23 (H26-29)	
23 (H26-30)	
23 (H26-31)	

表 27B-1



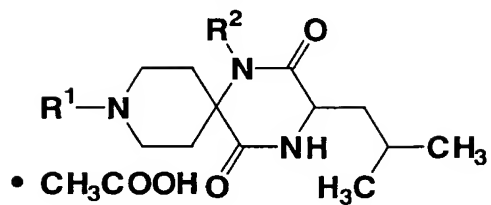
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-1)		
23 (H27-2)		
23 (H27-3)		
23 (H27-4)		
23 (H27-5)		
23 (H27-6)		
23 (H27-7)		
23 (H27-8)		

表 27B-2



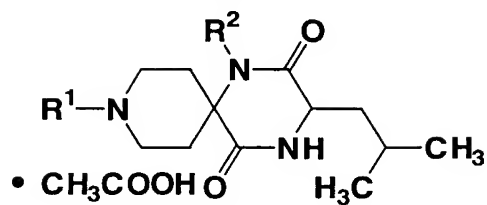
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-9)		
23 (H27-10)		
23 (H27-11)		
23 (H27-12)		
23 (H27-13)		
23 (H27-14)		

表 27B-3



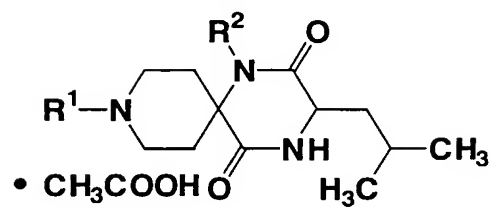
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-15)		
23 (H27-16)		
23 (H27-17)		
23 (H27-18)		
23 (H27-19)		
23 (H27-20)		
23 (H27-21)		

表 27B-4



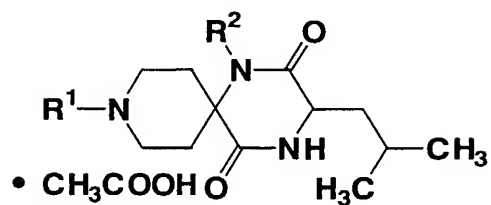
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-22)		
23 (H27-23)		
23 (H27-24)		
23 (H27-25)		
23 (H27-26)		
23 (H27-27)		
23 (H27-28)		
23 (H27-29)		

表 27B-5



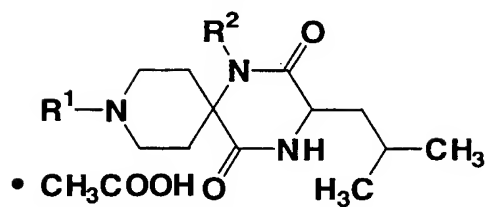
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-30)		
23 (H27-31)		
23 (H27-32)		
23 (H27-33)		
23 (H27-34)		
23 (H27-35)		
23 (H27-36)		
23 (H27-37)		

表 27B-6



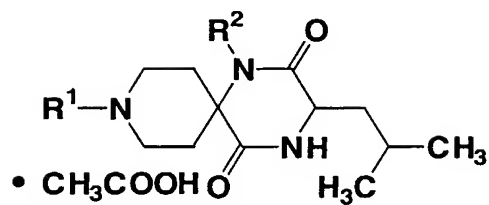
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-38)		
23 (H27-39)		
23 (H27-40)		
23 (H27-41)		
23 (H27-42)		
23 (H27-43)		
23 (H27-44)		
23 (H27-45)		

表 27B-7



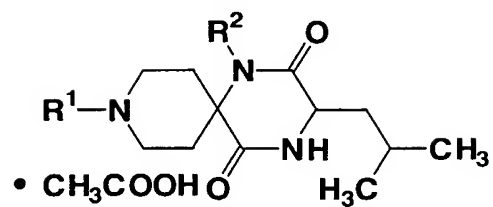
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-46)		
23 (H27-47)		
23 (H27-48)		
23 (H27-49)		
23 (H27-50)		
23 (H27-51)		
23 (H27-52)		
23 (H27-53)		

表 27B-8



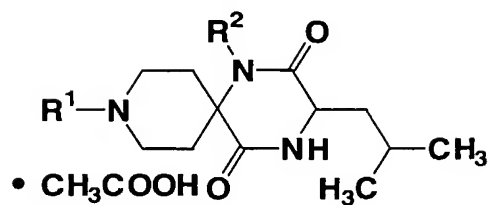
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-54)		
23 (H27-55)		
23 (H27-56)		
23 (H27-57)		
23 (H27-58)		
23 (H27-59)		
23 (H27-60)		

表 27B-9



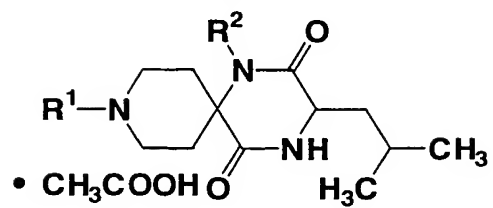
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-61)		
23 (H27-62)		
23 (H27-63)		
23 (H27-64)		
23 (H27-65)		
23 (H27-66)		
23 (H27-67)		

表 27B-10



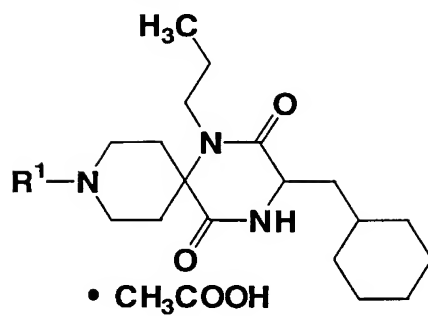
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-68)		
23 (H27-69)		
23 (H27-70)		
23 (H27-71)		
23 (H27-72)		
23 (H27-73)		
23 (H27-74)		
23 (H27-75)		

表 27B-11



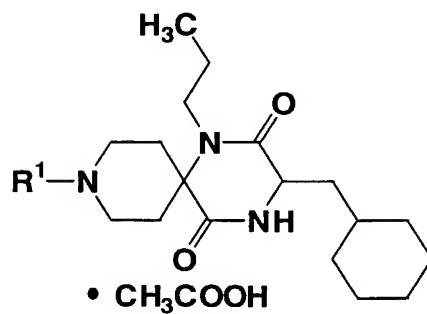
実施例番号	R ¹	R ²
23 (H27-76)		
23 (H27-77)		
23 (H27-78)		

表 28B-1



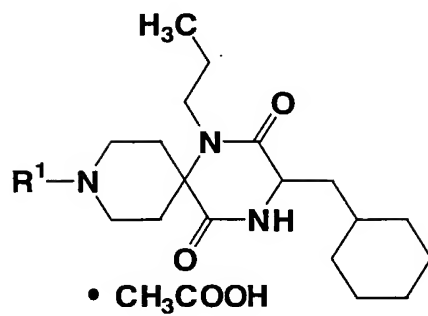
実施例番号	R ¹
23 (H28-1)	
23 (H28-2)	
23 (H28-3)	
23 (H28-4)	
23 (H28-5)	
23 (H28-6)	
23 (H28-7)	
23 (H28-8)	

表 28B-2



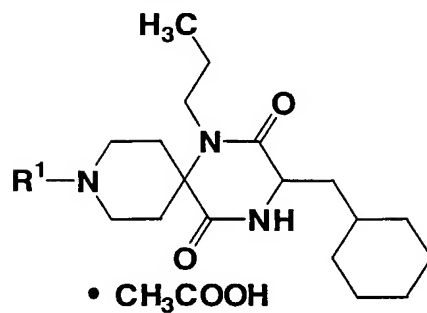
実施例番号	R ¹
23 (H28-9)	
23 (H28-10)	
23 (H28-11)	
23 (H28-12)	
23 (H28-13)	
23 (H28-14)	
23 (H28-15)	
23 (H28-16)	

表 28B-3



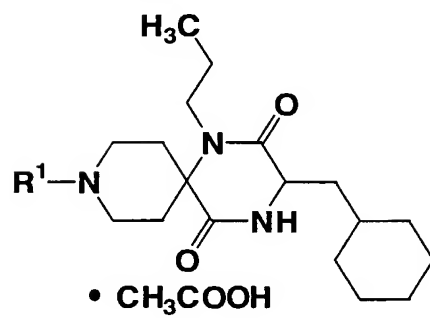
実施例番号	R ¹
23 (H28-17)	
23 (H28-18)	
23 (H28-19)	
23 (H28-20)	
23 (H28-21)	
23 (H28-22)	

表 28B-4



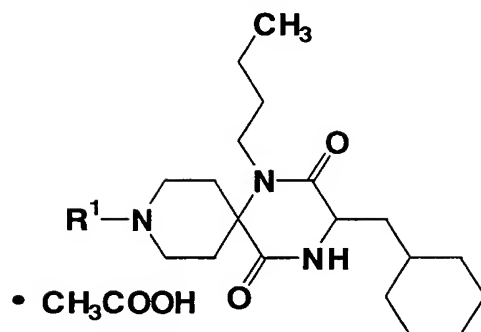
実施例番号	R ¹
23 (H28-23)	
23 (H28-24)	
23 (H28-25)	
23 (H28-26)	
23 (H28-27)	
23 (H28-28)	

表 28B-5



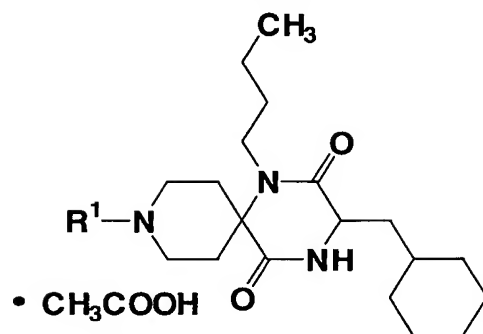
実施例番号	R ¹
23 (H28-29)	
23 (H28-30)	

表 29B-1



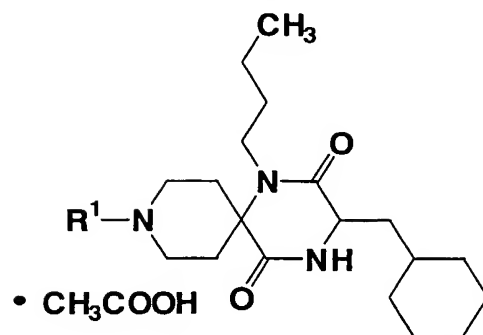
実施例番号	R ¹
23 (H29-1)	
23 (H29-2)	
23 (H29-3)	
23 (H29-4)	
23 (H29-5)	
23 (H29-6)	
23 (H29-7)	

表 29B-2



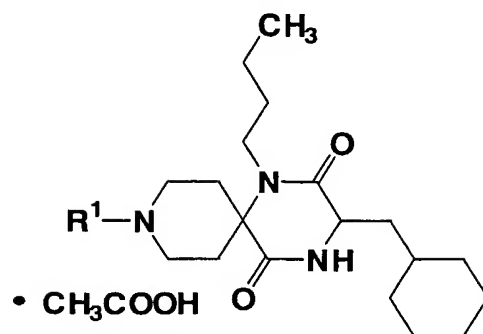
実施例番号	R ¹
23 (H29-8)	
23 (H29-9)	
23 (H29-10)	
23 (H29-11)	
23 (H29-12)	
23 (H29-13)	
23 (H29-14)	

表 29B-3



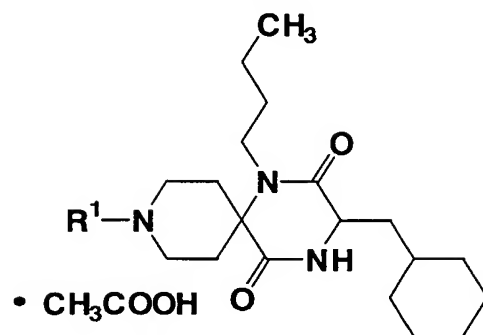
実施例番号	R ¹
23 (H29-15)	
23 (H29-16)	
23 (H29-17)	
23 (H29-18)	
23 (H29-19)	
23 (H29-20)	
23 (H29-21)	

表 29B-4



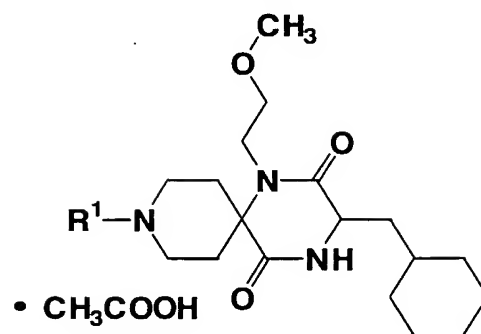
実施例番号	R ¹
23 (H29-22)	
23 (H29-23)	
23 (H29-24)	
23 (H29-25)	
23 (H29-26)	

表 29B-5



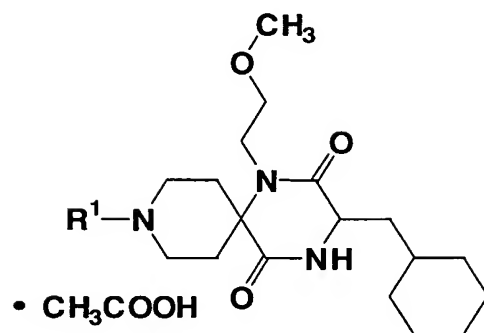
実施例番号	R ¹
23 (H29-27)	
23 (H29-28)	
23 (H29-29)	
23 (H29-30)	
23 (H29-31)	

表 30B-1



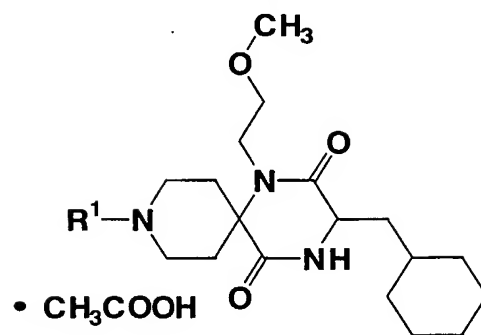
実施例番号	R ¹
23 (H30-1)	
23 (H30-2)	
23 (H30-3)	
23 (H30-4)	
23 (H30-5)	
23 (H30-6)	
23 (H30-7)	

表 30B-2



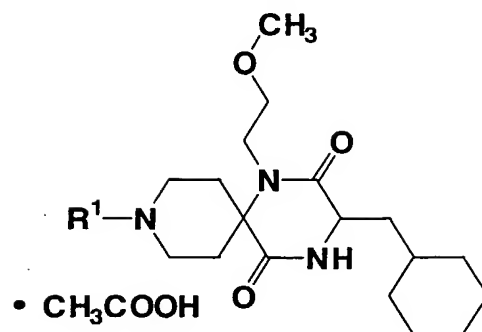
実施例番号	R ¹
23 (H30-8)	
23 (H30-9)	
23 (H30-10)	
23 (H30-11)	
23 (H30-12)	
23 (H30-13)	
23 (H30-14)	

表 30B-3



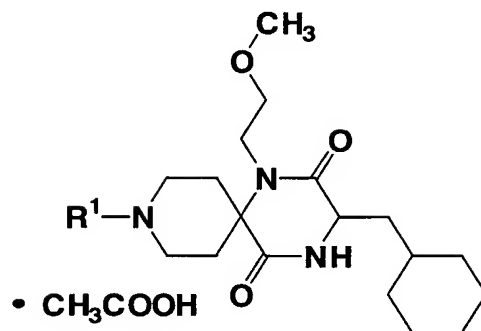
実施例番号	R ¹
23 (H30-15)	
23 (H30-16)	
23 (H30-17)	
23 (H30-18)	
23 (H30-19)	
23 (H30-20)	

表 30B-4



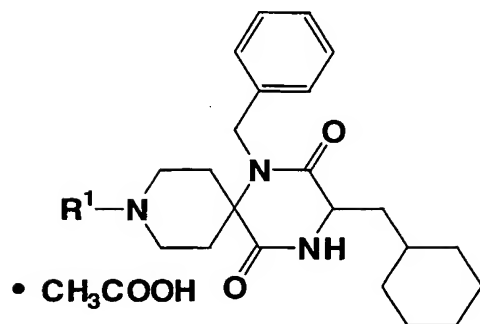
実施例番号	R ¹
23 (H30-21)	
23 (H30-22)	
23 (H30-23)	
23 (H30-24)	
23 (H30-25)	

表 30B-5



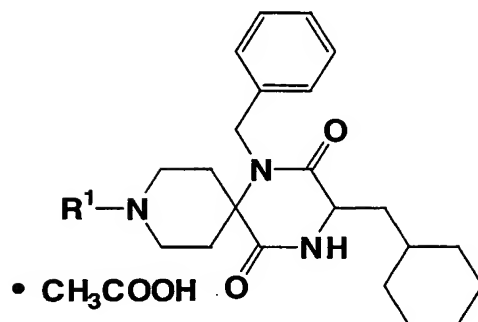
実施例番号	R ¹
23 (H30-26)	
23 (H30-27)	
23 (H30-28)	
23 (H30-29)	
23 (H30-30)	
23 (H30-31)	

表 31B-1



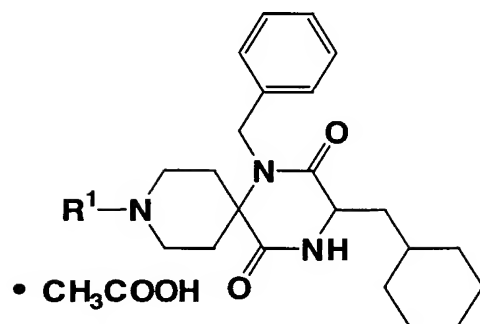
実施例番号	R ¹
23 (H31-1)	
23 (H31-2)	
23 (H31-3)	
23 (H31-4)	
23 (H31-5)	
23 (H31-6)	
23 (H31-7)	

表 31B-2



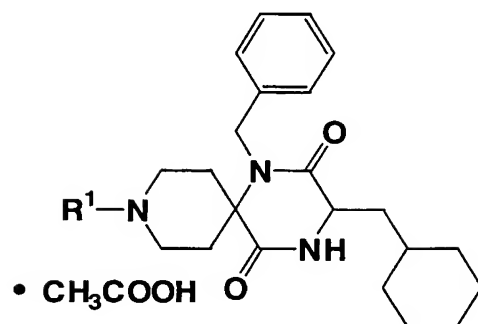
実施例番号	R ¹
23 (H31-8)	
23 (H31-9)	
23 (H31-10)	
23 (H31-11)	
23 (H31-12)	
23 (H31-13)	
23 (H31-14)	

表 31B-3



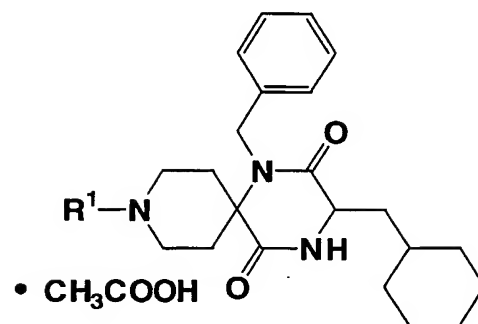
実施例番号	R ¹
23 (H31-15)	
23 (H31-16)	
23 (H31-17)	
23 (H31-18)	
23 (H31-19)	
23 (H31-20)	
23 (H31-21)	

表 31B-4



実施例番号	R ¹
23 (H31-22)	
23 (H31-23)	
23 (H31-24)	
23 (H31-25)	
23 (H31-26)	

表 31B-5



実施例番号	R ¹
23 (H31-27)	
23 (H31-28)	
23 (H31-29)	
23 (H31-30)	
23 (H31-31)	

表 22C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H22-1)	E	3.67	442 (M + H) ⁺ , 369.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-2)	E	3.67	442 (M + H) ⁺ , 440, 369.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-3)	E	3.22	400 (M + H) ⁺ , 398, 370, 327.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-4)	E	3.76	476 (M + H) ⁺ , 400.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-5)	E	3.36	586 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-6)	E	3.78	506 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-7)	E	3.73	506 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-8)	E	3.97	520 (M + H) ⁺ , 412, 356.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-9)	E	2.99	477 (M + H) ⁺ , 400.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-10)	E	3.70	442 (M + H) ⁺ , 412, 369.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-11)	E	4.03	526 (M + H) ⁺ , 453, 372.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-12)	E	4.06	482 (M + H) ⁺ , 409.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-13)	E	4.04	526 (M + H) ⁺ , 453, 372.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-14)	E	4.10	540 (M + H) ⁺ , 416.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-15)	E	4.29	582 (M + H) ⁺ , 492.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-16)	E	3.15	416 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-17)	E	4.29	582 (M + H) ⁺ , 492.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-18)	E	3.71	442 (M + H) ⁺ , 440, 412, 369.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-19)	E	4.05	482 (M + H) ⁺ , 452, 409.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-20)	E	3.97	520 (M + H) ⁺ , 478, 412.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-21)	E	3.89	506 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-22)	E	4.02	552 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-23)	E	4.03	522 (M + H) ⁺ , 432, 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-24)	E	3.20	386 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-25)	E	2.93	466 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-26)	E	3.79	416 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 22C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H22-27)	E	4.16	586 (M + H) ⁺ , 432, 398, 295.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-28)	E	3.34	556 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-29)	E	3.33	492 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-30)	E	4.12	625 (M + H) ⁺ , 491.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-31)	E	3.10	486 (M + H) ⁺ , 484.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-32)	E	4.06	526 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-33)	E	4.22	544 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-34)	E	3.90	488 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-35)	E	3.82	456 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-36)	E	3.11	428 (M + H) ⁺ , 355.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-37)	E	4.39	596 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-38)	E	3.18	430 (M + H) ⁺ , 386	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-39)	E	3.12	443 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-40)	E	3.18	430 (M + H) ⁺ , 386, 356.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-41)	E	3.22	400 (M + H) ⁺ , 398, 370, 327.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-42)	E	2.98	477 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-43)	E	3.17	444 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-44)	E	3.32	492 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-45)	E	4.53	460 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-46)	E	2.26	503 (M + H) ⁺ , 432, 398, 263.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-47)	E	3.20	430 (M + H) ⁺ , 386.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-48)	E	3.87	510 (M + H) ⁺ , 472.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-49)	E	4.11	526 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-50)	E	3.89	494 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-51)	E	3.27	425 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-52)	E	3.74	515 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 22C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H22-53)	E	4.19	625 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-54)	E	3.93	534 (M + H) ⁺ , 458.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-55)	E	4.08	667 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-56)	E	3.94	534 (M + H) ⁺ , 458.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-57)	E	4.02	591 (M + H) ⁺ , 457.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-58)	E	3.79	506 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-59)	E	4.01	591 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-60)	E	3.91	577 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-61)	E	3.47	586 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-62)	E	3.94	520 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-63)	E	4.33	552 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H22-64)	E	4.21	552 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 23C

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H23-1)	E	3.00	444 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-2)	E	3.07	416 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-3)	E	2.52	457 (M + H) ⁺ , 296, 162.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-4)	E	3.17	480 (M + H) ⁺ , 296, 217, 185.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-5)	E	3.80	492 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-6)	E	3.79	478 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-7)	E	3.43	442 (M + H) ⁺ , 402, 336, 296.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-8)	E	3.86	498 (M + Na) ⁺ , 476 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-9)	E	2.90	452 (M + H) ⁺ , 296.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-10)	E	3.57	484 (M + H) ⁺ , 332.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-11)	E	3.62	456 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-12)	E	3.22	497 (M + H) ⁺ , 336, 162.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-13)	E	3.69	520 (M + H) ⁺ , 185.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-14)	E	4.16	532 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-15)	E	4.16	518 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-16)	E	3.89	482 (M + H) ⁺ , 442, 376, 336.	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-17)	E	4.21	516 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
23 (H23-18)	E	3.48	492 (M + H) ⁺ , 336, 189, 157.	APCI (Pos., 40 V)

表 24C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H24-1)	F	3.07	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-2)	F	3.11	452 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-3)	F	3.04	362 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-4)	F	3.16	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-5)	F	3.07	378 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-6)	F	3.12	376 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-7)	F	2.74	359 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-8)	F	3.18	411 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-9)	F	2.76	362 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-10)	F	2.76	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-11)	F	3.35	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-12)	F	3.38	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-13)	F	3.12	397 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-14)	F	2.87	378 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-15)	F	2.92	408 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-16)	F	2.89	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-17)	F	3.18	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-18)	F	3.01	412 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-19)	F	3.44	508 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-20)	F	3.11	455 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-21)	F	3.53	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-22)	F	3.12	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-23)	F	3.49	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-24)	F	3.42	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-25)	F	3.16	439 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-26)	F	3.57	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 24C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H24-27)	F	3.18	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-28)	F	3.33	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-29)	F	3.38	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-30)	F	3.16	495 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H24-31)	F	3.38	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 25C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H25-1)	F	3.16	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-2)	F	3.18	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-3)	F	3.11	376 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-4)	F	3.23	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-5)	F	3.16	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-6)	F	3.20	390 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-7)	F	3.28	425 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-8)	F	2.85	376 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-9)	F	2.89	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-10)	F	3.44	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-11)	F	3.18	411 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-12)	F	3.45	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-13)	F	2.96	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-14)	F	3.27	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-15)	F	3.09	426 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-16)	F	3.53	522 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-17)	F	3.18	469 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-18)	F	3.60	574 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-19)	F	3.22	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-20)	F	3.55	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-21)	F	3.49	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-22)	F	3.25	453 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-23)	F	3.64	574 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-24)	F	3.25	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-25)	F	3.42	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-26)	F	3.47	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 25C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H25-27)	F	3.24	509 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H25-28)	F	3.47	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 26C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H26-1)	F	3.25	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-2)	F	3.26	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-3)	F	3.22	390 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-4)	F	3.33	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-5)	F	3.23	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-6)	F	3.29	404 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-7)	F	2.93	387 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-8)	F	3.34	439 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-9)	F	2.93	390 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-10)	F	2.97	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-11)	F	3.50	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-12)	F	3.52	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-13)	F	3.28	425 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-14)	F	3.04	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-15)	F	3.11	436 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-16)	F	3.04	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-17)	F	3.35	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-18)	F	3.20	440 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-19)	F	3.58	536 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-20)	F	3.25	483 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-21)	F	3.68	588 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-22)	F	3.30	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-23)	F	3.62	554 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-24)	F	3.57	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-25)	F	3.33	467 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-26)	F	3.71	588 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 26C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H26-27)	F	3.33	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-28)	F	3.49	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-29)	F	3.52	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-30)	F	3.32	523 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H26-31)	F	3.55	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 27C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H27-1)	F	3.31	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-2)	F	3.33	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-3)	F	3.31	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-4)	F	3.55	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-5)	F	3.58	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-6)	F	3.33	514 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-7)	F	3.16	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-8)	F	3.18	436 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-9)	F	3.31	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-10)	F	3.33	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-11)	F	3.33	508 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-12)	F	3.58	542 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-13)	F	3.60	556 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-14)	F	3.34	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-15)	F	3.18	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-16)	F	3.22	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-17)	F	3.29	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-18)	F	3.33	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-19)	F	3.56	542 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-20)	F	3.58	556 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-21)	F	3.33	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-22)	F	3.18	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-23)	F	3.20	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-24)	F	3.29	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-25)	F	3.31	508 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-26)	F	3.55	542 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 27C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H27-27)	F	3.56	556 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-28)	F	3.33	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-29)	F	3.17	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-30)	F	3.20	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-31)	F	2.92	421 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-32)	F	2.97	451 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-33)	F	2.96	479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-34)	F	3.22	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-35)	F	3.25	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-36)	F	3.00	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-37)	F	2.87	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-38)	F	2.83	437 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-39)	F	2.90	421 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-40)	F	2.94	451 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-41)	F	2.92	479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-42)	F	3.16	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-43)	F	3.20	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-44)	F	2.98	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-45)	F	2.85	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-46)	F	2.81	437 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-47)	F	2.89	421 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-48)	F	2.94	451 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-49)	F	2.92	479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-50)	F	3.16	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-51)	F	3.18	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-52)	F	2.98	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 27C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H27-53)	F	2.83	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-54)	F	2.81	437 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-55)	F	3.33	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-56)	F	3.36	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-57)	F	3.34	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-58)	F	3.60	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-59)	F	3.62	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-60)	F	3.36	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-61)	F	3.20	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-62)	F	3.23	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-63)	F	3.36	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-64)	F	3.38	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-65)	F	3.36	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-66)	F	3.62	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-67)	F	3.62	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-68)	F	3.38	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-69)	F	3.23	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-70)	F	3.25	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-71)	F	3.36	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-72)	F	3.38	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-73)	F	3.36	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-74)	F	3.62	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-75)	F	3.62	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-76)	F	3.36	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-77)	F	3.22	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H27-78)	F	3.23	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 28C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H28-1)	F	3.36	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-2)	F	3.37	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-3)	F	3.31	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-4)	F	3.42	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-5)	F	3.35	432 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-6)	F	3.41	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-7)	F	3.04	413 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-8)	F	3.45	465 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-9)	F	3.03	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-10)	F	3.77	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-11)	F	3.61	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-12)	F	3.61	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-13)	F	3.15	432 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-14)	F	3.22	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-15)	F	3.16	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-16)	F	3.46	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-17)	F	3.29	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-18)	F	3.68	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-19)	F	3.36	509 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-20)	F	3.76	614 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-21)	F	3.42	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-22)	F	3.71	580 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-23)	F	3.66	546 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-24)	F	3.44	493 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-25)	F	3.79	614 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-26)	F	3.42	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 28C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H28-27)	F	3.58	524 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-28)	F	3.62	546 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-29)	F	3.42	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H28-30)	F	3.62	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 29C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H29-1)	F	3.44	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-2)	F	3.44	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-3)	F	3.42	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-4)	F	3.53	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-5)	F	3.44	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-6)	F	3.49	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-7)	F	3.09	427 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-8)	F	3.53	479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-9)	F	3.11	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-10)	F	3.14	460 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-11)	F	3.67	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-12)	F	3.69	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-13)	F	3.47	465 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-14)	F	3.23	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-15)	F	3.29	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-16)	F	3.24	460 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-17)	F	3.55	460 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-18)	F	3.35	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-19)	F	3.73	576 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-20)	F	3.44	523 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-21)	F	3.83	628 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-22)	F	3.49	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-23)	F	3.77	594 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-24)	F	3.72	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-25)	F	3.52	507 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-26)	F	3.85	628 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 29C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H29-27)	F	3.51	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-28)	F	3.66	538 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-29)	F	3.69	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-30)	F	3.47	563 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H29-31)	F	3.68	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 30C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H30-1)	F	3.27	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-2)	F	3.31	522 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-3)	F	3.24	432 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-4)	F	3.34	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-5)	F	3.29	448 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-6)	F	3.33	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-7)	F	2.98	429 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-8)	F	3.38	481 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-9)	F	2.98	432 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-10)	F	3.01	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-11)	F	3.51	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-12)	F	3.55	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-13)	F	3.33	467 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-14)	F	3.09	448 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-15)	F	3.16	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-16)	F	3.09	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-17)	F	3.36	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-18)	F	3.22	482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-19)	F	3.60	578 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-20)	F	3.31	525 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-21)	F	3.69	630 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-22)	F	3.33	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-23)	F	3.64	596 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-24)	F	3.59	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-25)	F	3.34	509 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-26)	F	3.71	630 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 30C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H30-27)	F	3.34	542 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-28)	F	3.51	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-29)	F	3.53	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-30)	F	3.34	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H30-31)	F	3.55	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 31C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H31-1)	F	3.47	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-2)	F	3.47	554 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-3)	F	3.45	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-4)	F	3.55	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-5)	F	3.47	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-6)	F	3.53	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-7)	F	3.14	461 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-8)	F	3.56	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-9)	F	3.14	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-10)	F	3.20	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-11)	F	3.69	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-12)	F	3.71	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-13)	F	3.51	499 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-14)	F	3.27	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-15)	F	3.33	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-16)	F	3.29	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-17)	F	3.58	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-18)	F	3.40	514 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-19)	F	3.75	610 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-20)	F	3.49	557 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-21)	F	3.86	662 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-22)	F	3.53	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-23)	F	3.80	628 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-24)	F	3.75	594 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-25)	F	3.57	541 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-26)	F	3.86	662 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 31C-2

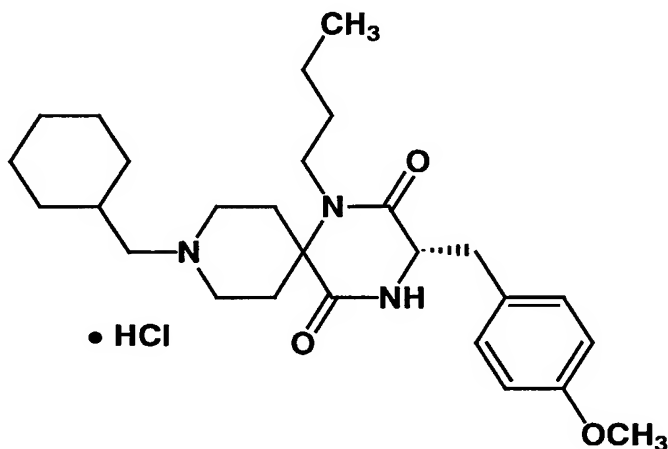
実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
23 (H31-27)	F	3.53	574 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-28)	F	3.67	572 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-29)	F	3.71	594 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-30)	F	3.51	597 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
23 (H31-31)	F	3.73	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

実施例 24 (1) ~ 24 (119)

参考例 2 で製造した樹脂 (3) および N-アリルオキシカルボニル-4-
 ピペリドンと、n-プロピルアミンおよび N-(t-ブチルオキシカルボニル)
 ロイシンの代わりにそれぞれ相当する化合物を用いて、参考例 3 → 参考
 5 例 4 と同様の操作をし、さらに 3, 5-ジメチル-1-フェニル-4-ホル
 ミルピラゾールの代わりに、相当する化合物を用いて、参考例 5 → 参考例 6
 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の本発明化合物を得た。

実施例 24 (1)

- 10 (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(4-メトキシフェニルメ
 チル)-9-シクロヘキシルメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]
 ウンデカン・塩酸塩



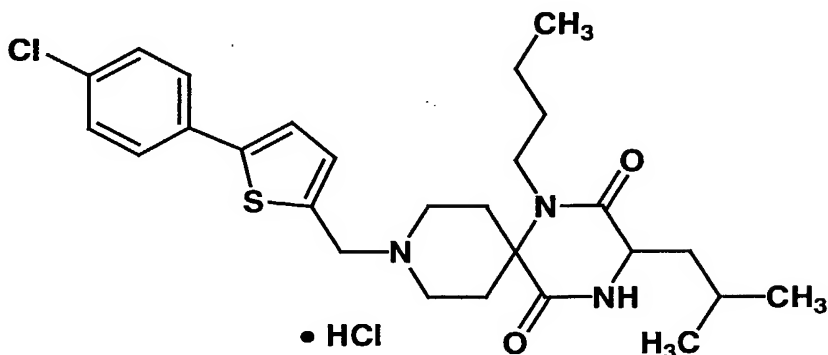
TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 15 NMR (CD₃OD) : δ 7.06 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.84 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.31 (dd,
 J = 4.5, 3.6 Hz, 1H), 3.82-3.67 (m, 4H), 3.49-3.30 (m, 3H), 3.25 (dd, J = 13.8, 3.6
 Hz, 1H), 3.23-3.10 (m, 2H), 2.95-2.87 (m, 2H), 2.87 (dd, J = 13.8, 4.5 Hz, 1H),
 2.31 (m, 1H), 2.05 (m, 1H), 1.91-1.64 (m, 7H), 1.56-1.14 (m, 7H), 1.09-0.91 (m,

5H), 0.26 (m, 1H)。

実施例 2 4 (2)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(4-クロロフェニル)チオフェン-5-イルメチル)-1,4,9-トリ
アザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

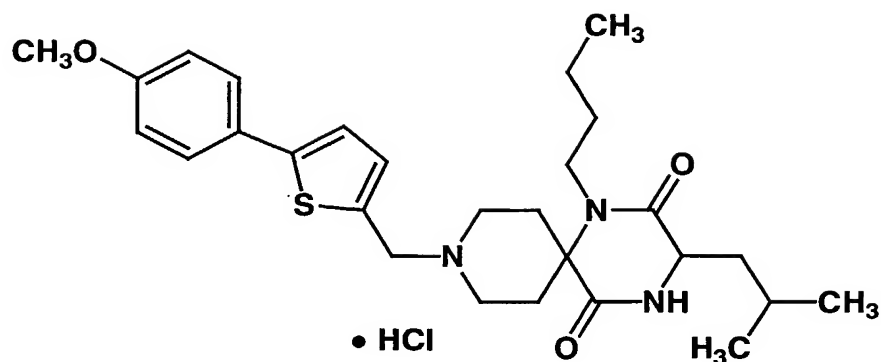


TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.65 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.61 (brs, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.72 (m, 2H), 3.65-3.50 (m, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.50-2.12 (m, 4H), 1.89-1.45 (m, 5H), 1.45-1.28 (m, 2H), 1.13-0.89 (m, 9H)。

実施例 2 4 (3)

15 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(4-メトキシフェニル)チオフェン-5-イルメチル)-1,4,9-トリ
アザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

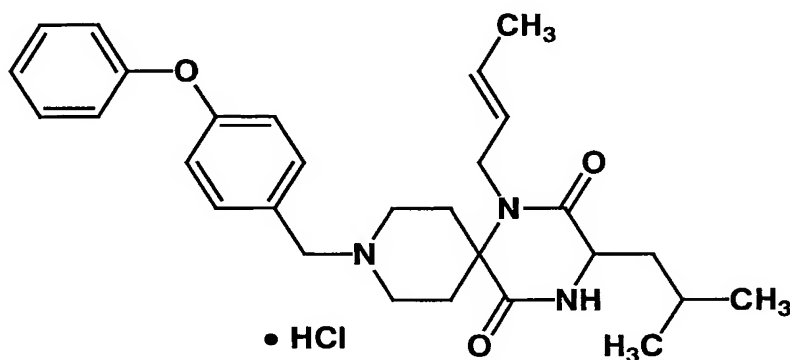


TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.33-7.26 (m, 2H), 6.97 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.58 (brs, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.71 (m, 5H), 3.64-3.50 (m, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.49-2.12 (m, 4H), 1.90-1.45 (m, 5H), 1.45-1.28 (m, 2H), 1.03-0.88 (m, 9H)。

実施例 24 (4)

1 - ((2E) - 2 - ブテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン ・ 塩酸塩



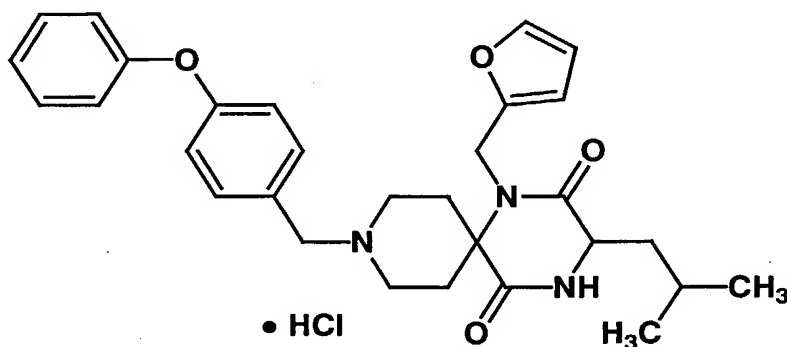
TLC : R_f 0.32 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.44-7.35 (m, 2H), 7.22-7.14 (m, 1H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.10-7.00 (m, 2H), 5.75-5.60 (m, 1H), 5.52-5.38 (m,

1H), 4.33 (s, 2H), 4.15-3.93 (m, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.66 (m, 2H), 3.55-3.42 (m, 2H), 2.52-2.35 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.90-1.57 (m, 3H), 1.65 (dd, J = 6.3, 1.5 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5 実施例 2 4 (5)

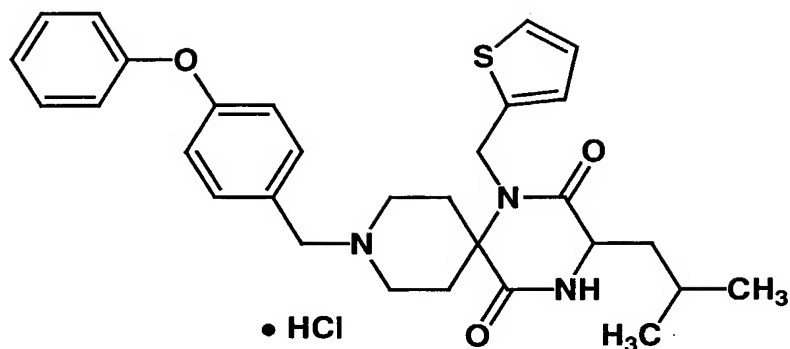
1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



- 10 TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.36 (m, 3H), 7.18 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.09-6.99 (m, 4H), 6.33 (m, 1H), 6.28 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 4.69 (s, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.08 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.87-3.72 (m, 2H), 3.57-3.42 (m, 2H), 2.65-2.38 (m, 2H), 2.30-2.12 (m, 2H), 1.90-1.56 (m, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H),
 15 0.91 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 2 4 (6)

- 1 - (チオフェン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 -
 20 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

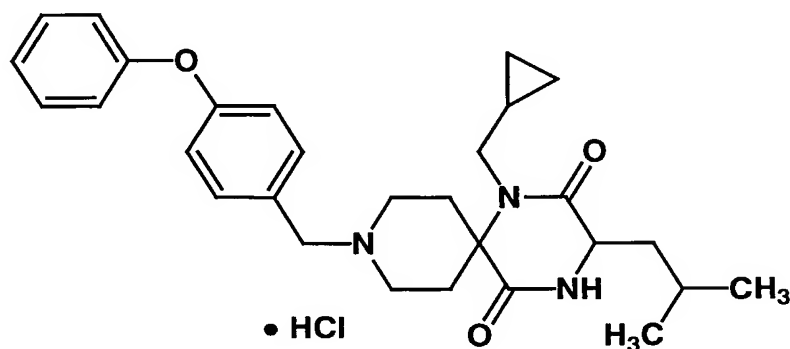


TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.34 (m, 2H), 7.27 (dd, J = 5.1, 1.2 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 5H), 6.91 (dd, J = 5.1, 3.3 Hz, 1H), 4.92 (brs, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.11 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.66 (m, 2H), 3.53-3.41 (m, 2H), 2.68-2.46 (m, 2H), 2.23-2.06 (m, 2H), 1.95-1.59 (m, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 6H)。

実施例 24 (7)

- 10 1-シクロプロピルメチルー 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

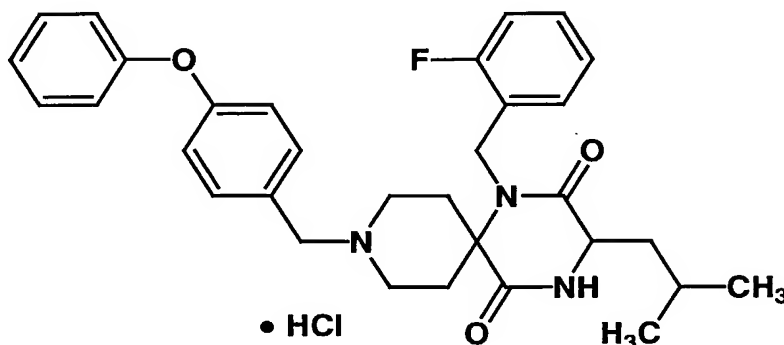
15 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.2

Hz, 1H), 7.08-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.87-3.68 (m, 2H), 3.56-3.43 (m, 2H), 3.46-3.35 (m, 2H), 2.56-2.35 (m, 2H), 2.23-2.12 (m, 2H), 1.95-1.58 (m, 3H), 1.10-0.95 (m, 1H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 0.56-0.45 (m, 2H), 0.42-0.34 (m, 2H)。

5

実施例 24 (8)

1 - (2-フルオロフェニルメチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.42-7.34 (m, 2H), 7.32-7.21 (m, 1H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.14-7.06 (m, 3H), 7.06-6.98 (m, 4H), 4.80 (brs, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.18 (dd, J = 8.1, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.68 (m, 2H), 3.50-3.35 (m, 2H), 2.50-2.30 (m, 1H), 2.30-2.14 (m, 3H), 1.94-1.62 (m, 3H), 0.97 (d, J = 6.3 Hz, 6H)。

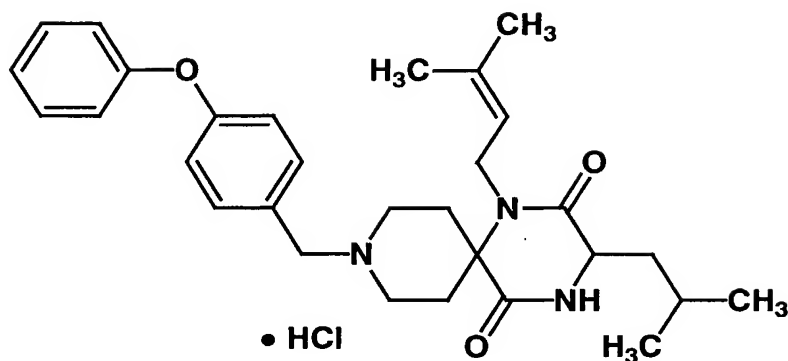
15

実施例 24 (9)

1 - (3-メチル-2-ブテニル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-ト

20

リアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

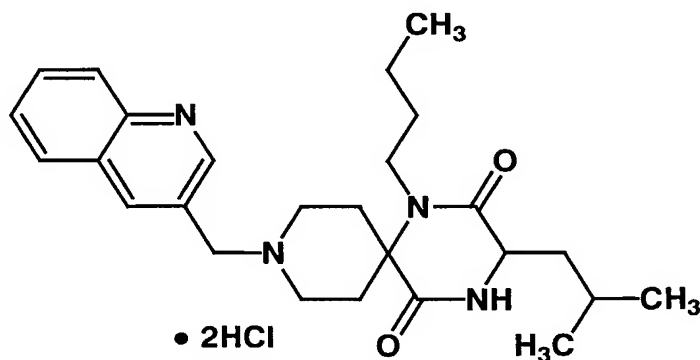


TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 4H), 4.97 (br, 1H), 4.32 (s, 2H), 4.20-4.00 (m, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.68 (m, 2H), 3.55-3.45 (m, 2H), 2.52-2.32 (m, 2H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.90-1.56 (m, 3H), 1.74 (s, 3H), 1.69 (s, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

10 実施例 24 (10)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(キノリン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

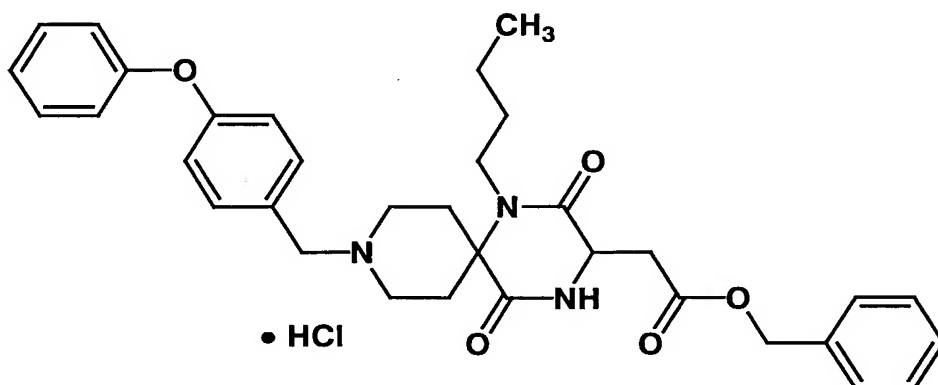


TLC : Rf 0.25 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 9.52 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 9.35 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.24-8.16 (m, 1H), 8.04-7.96 (m, 1H), 4.76 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 4.00-3.85 (m, 2H), 3.68-3.55 (m, 2H), 3.55-3.43 (m, 2H), 2.76-2.56 (m, 2H), 2.27-2.05 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.05-0.83 (m, 2H), 0.92 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 24 (11)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(ベンジルオキシカルボニルメチル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

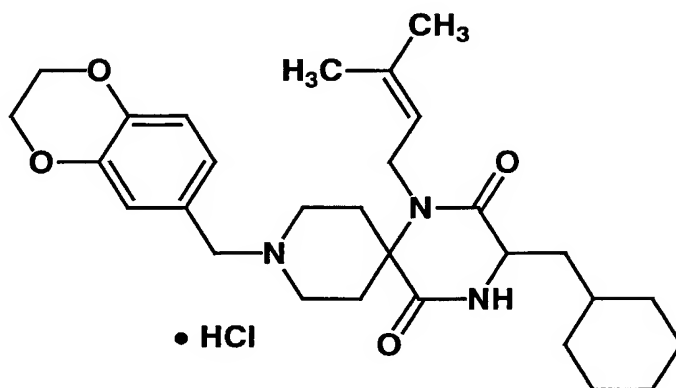


TLC : Rf 0.74 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.33 (m, 5H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.05 (m, 4H), 5.12 (s, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.31 (m, 1H), 3.88 (m, 1H), 3.66 (m, 1H), 3.50-3.35 (m, 4H), 3.08 (dd, J = 17.7, 4.8 Hz, 1H), 2.86 (dd, J = 17.7, 3.0 Hz, 1H), 2.34 (m, 2H), 2.25 (m, 2H), 1.50 (m, 2H), 1.36 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 2 4 (1 2)

1 - (3 - メチル - 2 - ブテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシル
 メチル - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4,
 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



5

TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

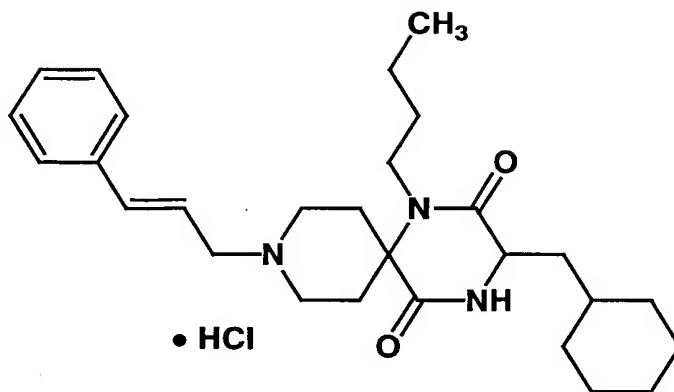
NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92
 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.96 (m, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.22 (s, 2H), 4.10-4.00 (m, 3H),
 3.84-3.68 (m, 2H), 3.52-3.40 (m, 2H), 2.43-2.08 (m, 4H), 1.84-1.42 (m, 13H),
 1.38-1.12 (m, 4H), 1.04-0.85 (m, 2H)。

10

実施例 2 4 (1 3)

1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - ((2 E)
 - 3 - フェニル - 2 - プロペニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン・塩酸塩

15

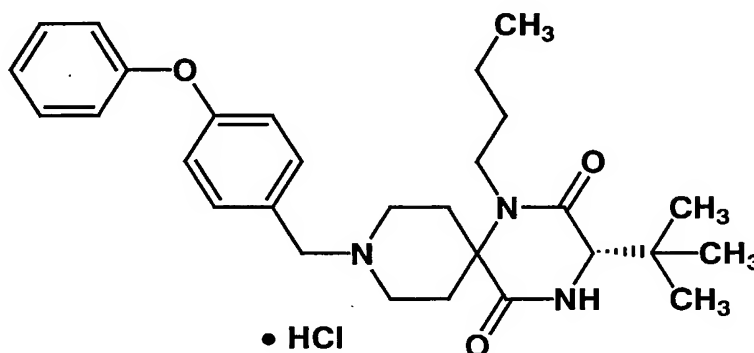


TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53-7.48 (m, 2H), 7.30-7.40 (m, 3H), 6.95 (d, J = 16.2 Hz, 1H), 6.36 (dd, J = 16.2, 8.1 Hz, 1H), 4.07 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 3.86-3.75 (m, 2H), 3.60-3.52 (m, 2H), 3.42-3.34 (m, 2H), 2.42-2.18 (m, 4H), 1.82-1.14 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 24 (14)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1, 1 - ジメチルエチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



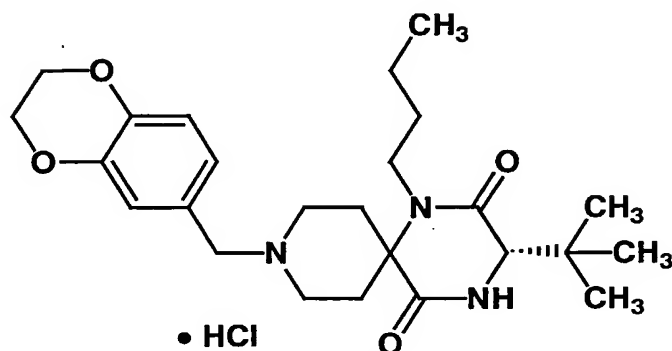
TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.39 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz,

1H), 7.08-7.02 (m, 4H), 4.34 (s, 2H), 3.88 (m, 2H), 3.62 (s, 1H), 3.46 (m, 4H), 2.45 (m, 2H), 2.13 (m, 2H), 1.66-1.47 (m, 2H), 1.36 (m, 2H), 1.02 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

5 実施例 2 4 (1 5)

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1, 1 - ジメチルエチル) - 9 - (1, 4 - ペンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

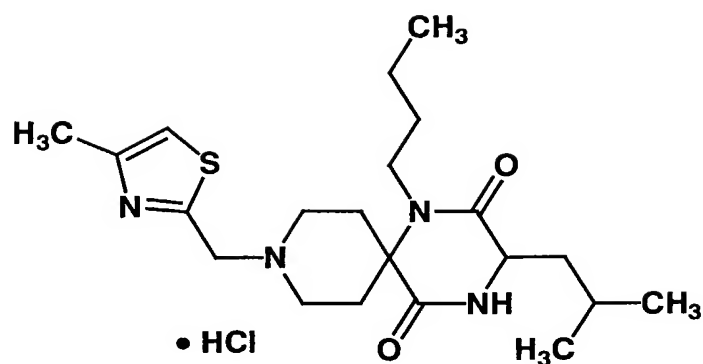


- 10 TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.07 (m, 1H), 6.99 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.91 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.26 (m, 4H), 4.24 (s, 2H), 3.83 (m, 2H), 3.62 (s, 1H), 3.45 (m, 4H), 2.42 (m, 2H), 2.11 (m, 2H), 1.64-1.5 (m, 2H), 1.38 (m, 2H), 1.01 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

15

実施例 2 4 (1 6)

1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

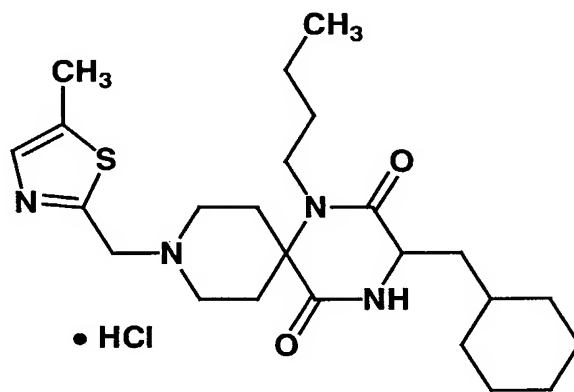


TLC : R_f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.34 (s, 1H), 4.73 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 8.0, 4.5 Hz, 1H), 3.93 (m, 2H), 3.65 (m, 2H), 3.41 (m, 2H), 2.53-2.41 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.23 (m, 2H), 1.85-1.52 (m, 5H), 1.38 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 24 (17)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



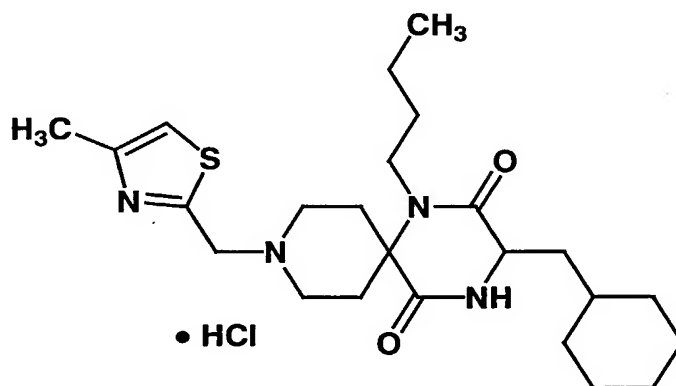
TLC : R_f 0.66 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.34 (s, 1H), 4.72 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H),

3.98-3.86 (m, 2H), 3.67-3.63 (m, 2H), 3.44-3.38 (m, 2H), 2.56-2.42 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.30-2.14 (m, 2H), 1.84-1.18 (m, 15H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

5 実施例 24 (18)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

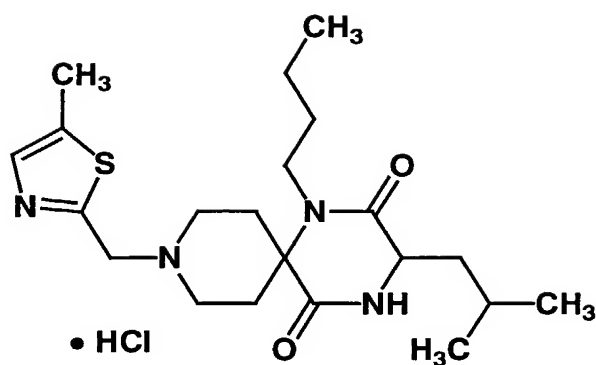


- 10 TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.63 (s, 1H), 4.69 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.3, 4.5$ Hz, 1H), 3.96-3.82 (m, 2H), 3.72-3.58 (m, 2H), 3.42-3.37 (m, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.56-2.36 (m, 2H), 2.28-2.12 (m, 2H), 1.80-1.12 (m, 15H), 0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

15

実施例 24 (19)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

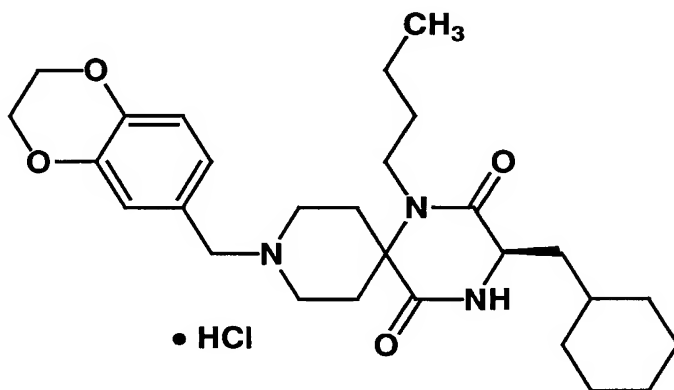


TLC : R_f 0.70 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.63 (s, 1H), 4.69 (brs, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.99-3.83 (m, 2H), 3.70-3.58 (m, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.53 (s, 3H), 2.50-2.33 (m, 2H), 2.32-2.12 (m, 2H), 1.88-1.46 (m, 5H), 1.45-1.31 (m, 2H), 1.01-0.90 (m, 9H)。

実施例 24 (20)

(3R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.5, 2.0 Hz, 1H), 6.93

(d, $J = 8.5$ Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.24 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.5, 5.0$ Hz, 1H), 3.76 (m, 2H), 3.46 (m, 4H), 2.39-2.11 (m, 4H), 1.78-1.17 (m, 15H), 0.95 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

HPLC条件

- 5 使用したカラム：YMC CHIRAL-CD BR、 0.46×25 cm、YMC、DB12S05-2546WTI；

使用した流速：0.5mL/min；

使用した溶媒

A液：0.1Mリン酸二水素カリウム水溶液

- 10 B液：アセトニトリル

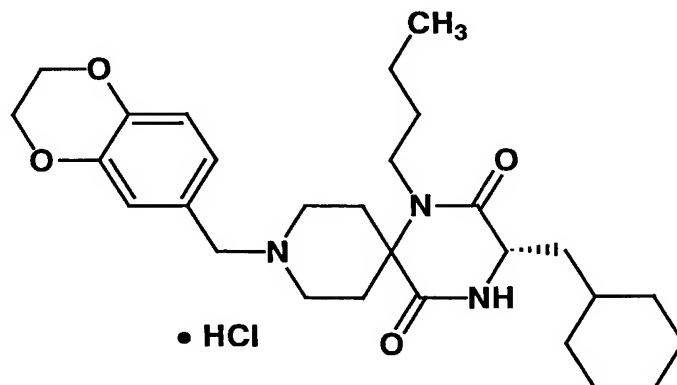
A：B = 84：16；

使用したUV：235nm；

保持時間：18min。

- 15 実施例24(21)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.5, 2.0 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.24 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 5.0 Hz, 1H), 3.76 (m, 2H), 3.46 (m, 4H), 2.39-2.11 (m, 4H), 1.78- 1.17 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

HPLC 条件

使用したカラム : YMC CHIRAL-CD BR、0.46×25cm、YMC、DB12S05-2546WTI ;

使用した流速 : 0.5mL / min ;

10 使用した溶媒

A液 : 0.1Mリン酸二水素カリウム水溶液

B液 : アセトニトリル

A : B = 84 : 16 ;

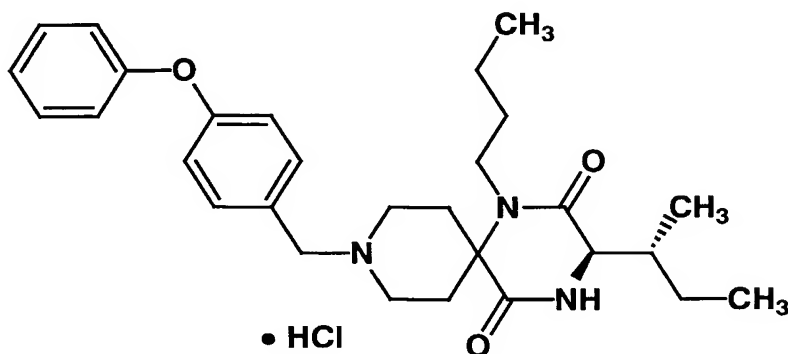
使用したUV : 235 nm ;

15 保持時間 : 20 min。

実施例 24 (22)

(3R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

20 アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

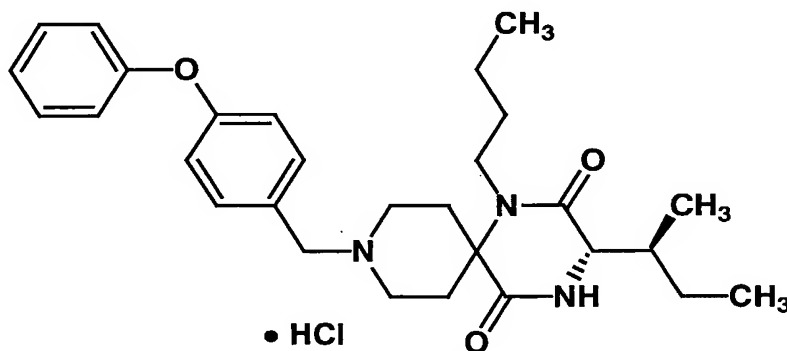


TLC : Rf 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.39 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.08-7.01 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 3.96 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 3.92 (m, 1H), 3.75 (m, 1H), 3.53-3.44 (m, 4H), 2.49-2.32 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 2.06-1.98 (m, 1H),
 5 1.61-1.21 (m, 6H), 1.00-0.89 (m, 9H)。

実施例 24 (23)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1S) - 1 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩
 10



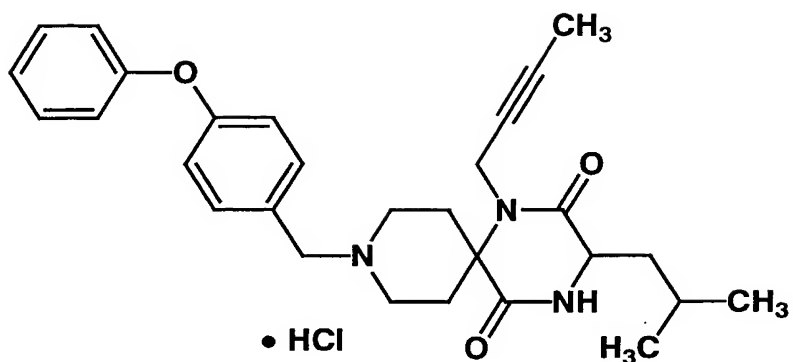
TLC : Rf 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.39 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.08-7.01 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 3.96 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 3.92 (m, 1H), 3.75 (m, 1H), 3.53-3.44 (m, 4H), 2.49-2.32 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 2.06-1.98 (m, 1H),
 15 1.61-1.21 (m, 6H), 1.00-0.89 (m, 9H)。

実施例 24 (24)

1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ
 20

[5. 5] ウンデカン・塩酸塩

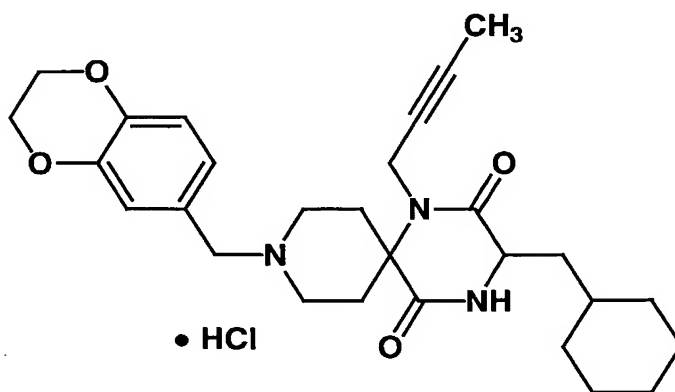


TLC : R_f 0.70 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.2 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 4H), 4.33 (brs, 2H), 4.28-4.10 (m, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.70 (m, 2H), 3.56-3.43 (m, 2H), 2.59-2.40 (m, 2H), 2.34-2.15 (m, 2H), 1.89-1.57 (m, 6H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

10 実施例 24 (25)

1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

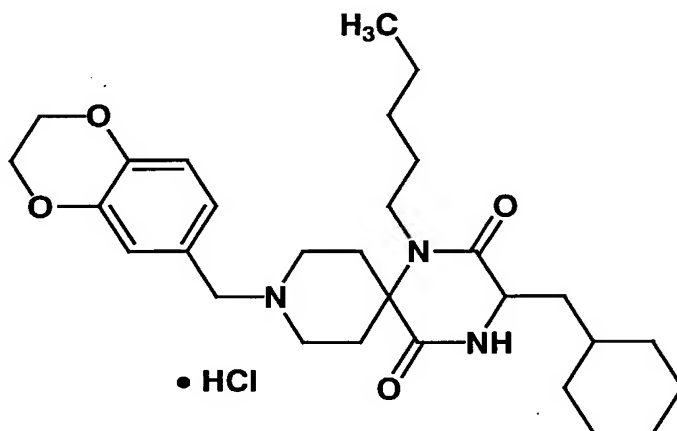


TLC : Rf 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.18 (brs, 2H), 4.07 (dd, J = 6.9, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.55-3.42 (m, 2H), 2.57-2.40 (m, 2H), 2.32-2.12 (m, 2H), 1.85-1.42 (m, 11H), 1.38-1.13 (m, 3H), 1.04-0.85 (m, 2H)。

実施例 24 (26)

1-ペンチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

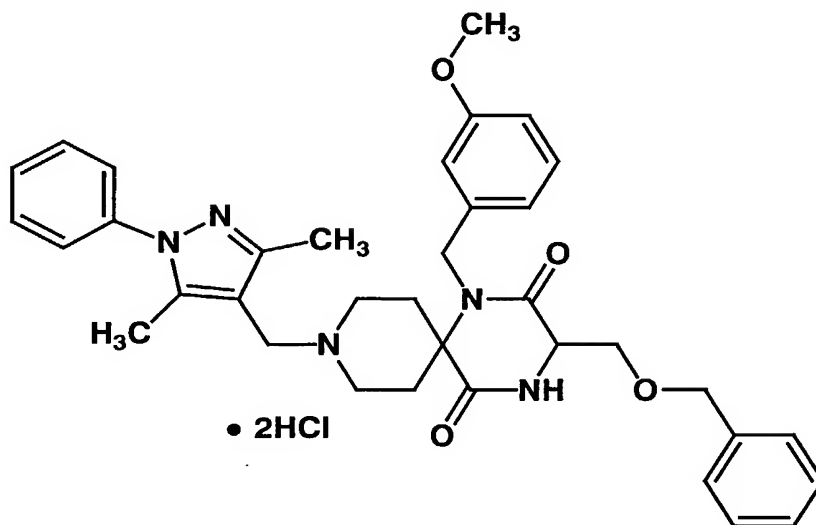


TLC : Rf 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.22 (brs, 2H), 4.03 (dd, J = 7.2, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.67 (m, 2H), 3.52-3.33 (m, 4H), 2.43-2.07 (m, 4H), 1.83-1.42 (m, 9H), 1.41-1.13 (m, 8H), 1.04-0.85 (m, 5H)。

実施例 24 (27)

1 - (3 - メトキシフェニルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (ベンジル
 オキシメチル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 -
 イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸
 塩



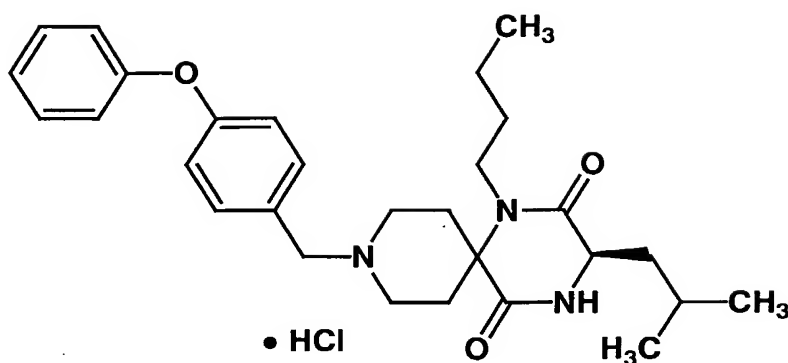
5

TLC : R_f 0.45 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.43 (m, 5H), 7.38-7.24 (m, 5H), 7.14 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 6.83-6.72 (m, 3H), 4.96-4.70 (m, 2H), 4.60 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 4.50 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 4.29 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 4.24 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 9.6, 2.4 Hz, 1H),
 10 3.93-3.79 (m, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.70 (dd, J = 9.6, 2.4 Hz, 1H), 3.70-3.60 (m, 1H), 3.55-3.44 (m, 1H), 3.35-3.23 (m, 1H), 2.58-2.05 (m, 10H)。

実施例 24 (28)

(3R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 15 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ
 [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.18 (m, 1H),
 7.05 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.05 - 7.02 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8
 5 Hz, 1H), 3.85-3.72 (m, 2H), 3.50-3.39 (m, 4H), 2.52-2.38 (m, 2H), 2.24-2.11 (m,
 2H), 1.84-1.20 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d,
 J = 6.3 Hz, 3H)。

HPLC条件

使用したカラム : CHIRALCEL OD-R, 0.46×25cm, DAICEL, ODR0CE-HD028 ;

10 使用した流速 : 0.4mL / min ;

使用した溶媒

A液 : 0.2Mリン酸二水素カリウム水溶液

B液 : アセトニトリル

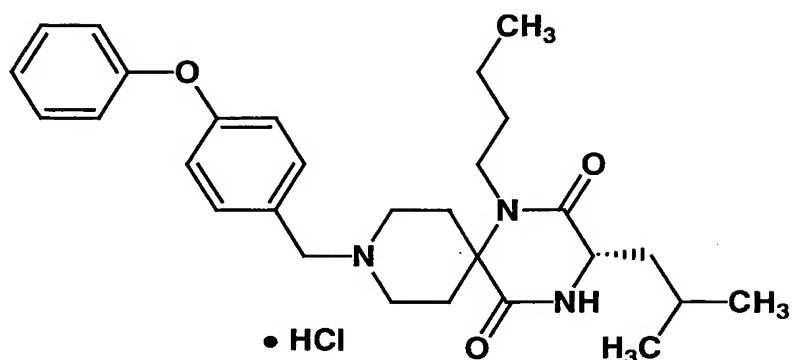
A : B = 64 : 36 ;

15 使用したUV : 235 nm ;

保持時間 : 30 min。

実施例 24 (29)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 20 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ
 [5.5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.18 (m, 1H), 7.05 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.05-7.02 (m, 2H), 4.33 (s, 2H), 3.98 (dd, J = 8.1, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.72 (m, 2H), 3.53-3.37 (m, 4H), 2.47-2.36 (m, 2H), 2.24-2.12 (m, 2H), 1.80-1.30 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

HPLC条件

使用したカラム : CHIRALCEL OD-R、0.46×25cm、DAICEL、ODR0CE-HD028 ;

10 使用した流速 : 0.4mL / min ;

使用した溶媒

A液 : 0.2Mリン酸二水素カリウム水溶液

B液 : アセトニトリル

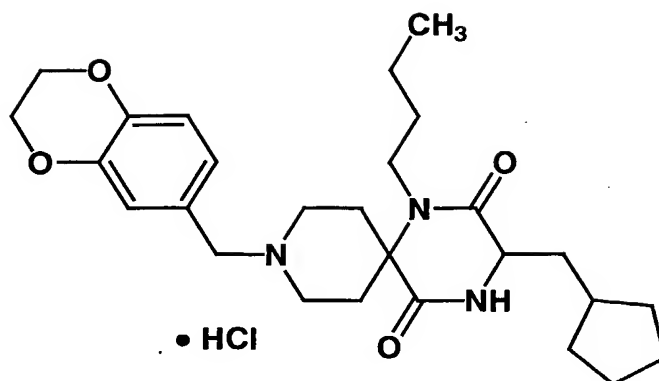
A : B = 64 : 36 ;

15 使用したUV : 235 nm ;

保持時間 : 28 min。

実施例 24 (30)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロペンチルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサ-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

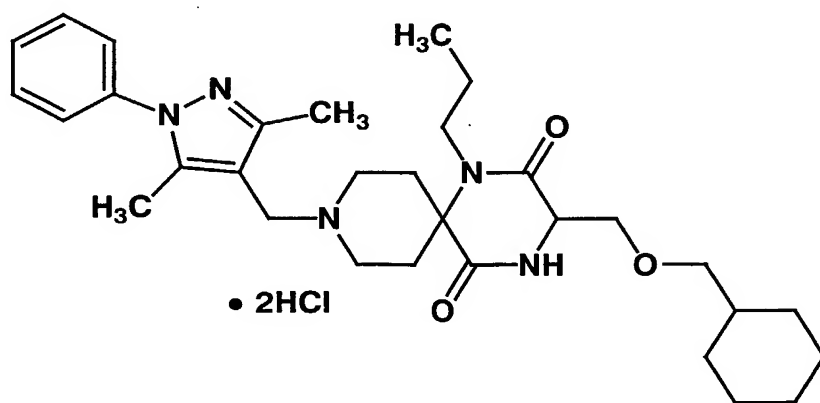


TLC : R_f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.05 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.5, 2.0 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 3.99 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 3.77 (m, 2H), 3.46 (m, 2H), 3.37 (m, 2H), 2.36 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 1.96 (m, 1H), 1.81 (m, 4H), 1.59 (m, 6H), 1.36 (m, 2H), 1.15 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 24 (31)

1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(シクロヘキシルメチルオキシメチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



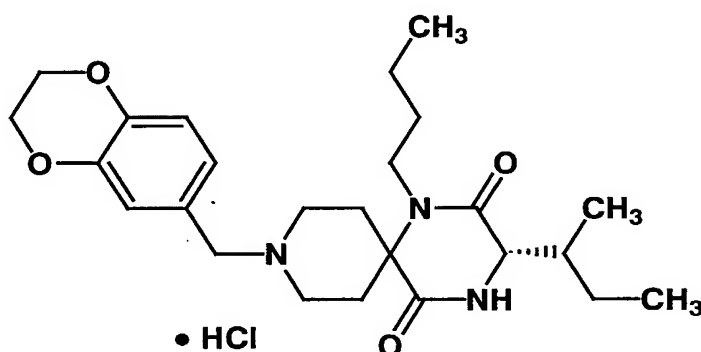
TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.46 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.08 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.83 (m, 1H), 3.77 (m, 1H), 3.59 (m, 2H), 3.52 (m, 1H), 3.25 (d, J = 6.5 Hz, 2H), 2.53 (m, 2H), 2.42 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.69 (m, 6H), 1.52 (m, 2H), 1.21 (m, 4H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.88 (m, 2H)。

5

実施例 2 4 (3 2)

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1 - メチルプロピル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

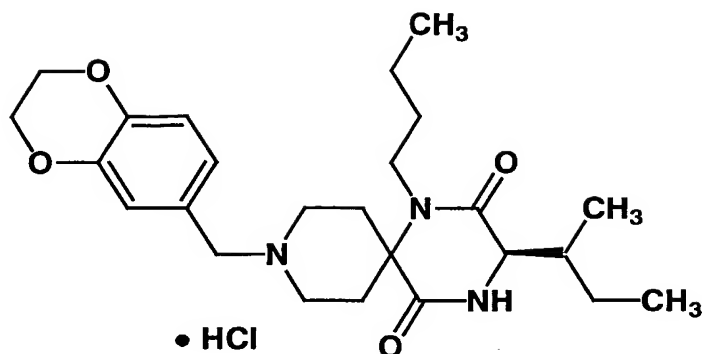
NMR (CD₃OD) : δ 7.06-6.90 (m, 3H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 3.95 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 3.87 (m, 1H), 3.70 (m, 1H), 3.58-3.42 (m, 4H), 2.56-2.30 (m, 2H), 2.20-1.98 (m, 2H), 1.54-1.00 (m, 7H), 0.99 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.91 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

15

実施例 2 4 (3 3)

(3 R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1 - メチルプロピル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

20

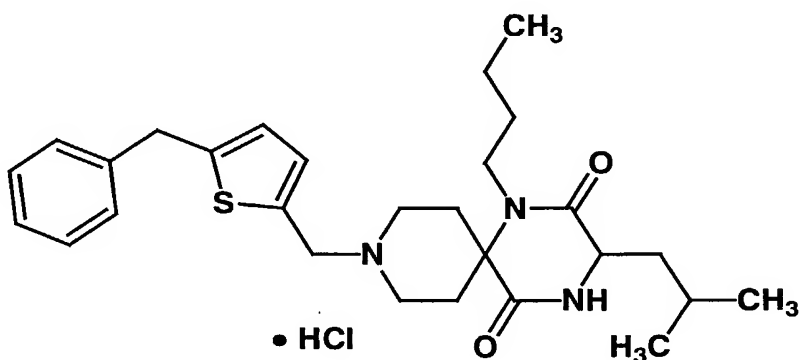


TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.06-6.91 (m, 3H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 3.95 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 3.87 (m, 1H), 3.70 (m, 1H), 3.56-3.40 (m, 4H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.18-1.96 (m, 2H), 1.62-1.17 (m, 7H), 0.99 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.91 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 24 (34)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-フェニルメチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



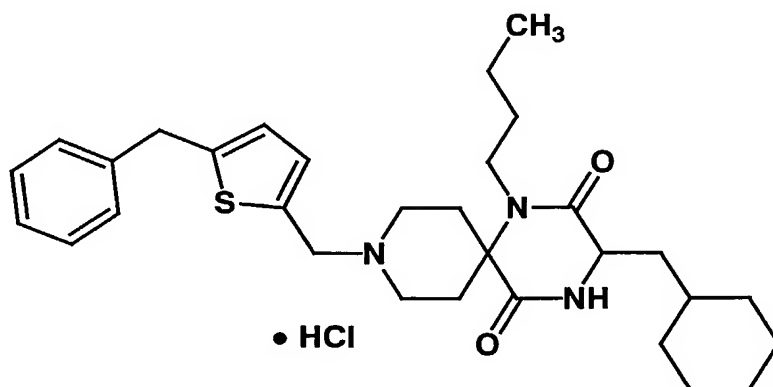
TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.32-7.21 (m, 5H), 7.17 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.51 (s, 2H), 4.17 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8 Hz, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.72 (m,

2H), 3.56-3.44 (m, 2H), 3.38-3.32 (m, 2H), 2.42-2.14 (m, 4H), 1.84-1.30 (m, 7H), 0.95 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 2 4 (3 5)

- 5 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-フェニルメチルチオフェン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

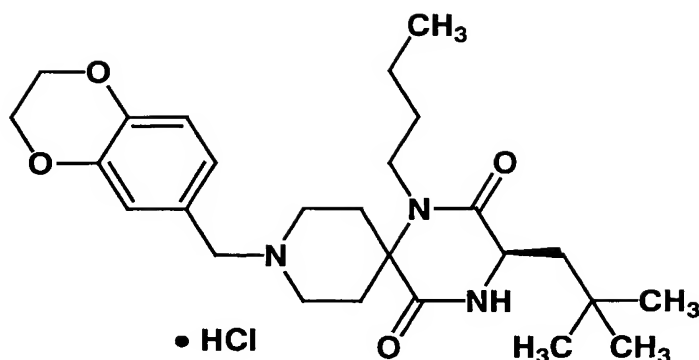


TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.32-7.21 (m, 5H), 7.18 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.51 (s, 2H), 4.17 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.72 (m, 2H), 3.58-3.44 (m, 2H), 3.40-3.36 (m, 2H), 2.44-2.08 (m, 4H), 1.81-1.07 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

15 実施例 2 4 (3 6)

(3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

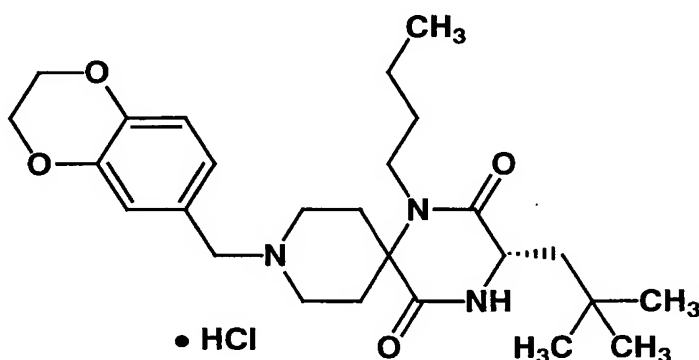


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.05 (s, 1H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.0, 3.0 Hz, 1H), 3.83 - 3.64 (m, 2H),
 5 3.50 (m, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 2.25 (m, 2H), 1.99 (m, 1H), 1.55 (m, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.35 (m, 2H), 0.99 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 24 (37)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2, 2 - ジメチルプロピ
 10 ル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 -
 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



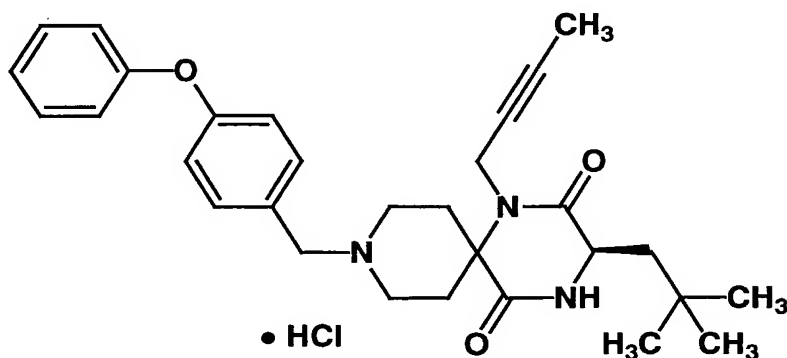
TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.05 (s, 1H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.0, 3.0 Hz, 1H), 3.83 - 3.63 (m, 2H),
 15 1H), 3.50 (m, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 2.25 (m, 2H), 1.99 (m, 1H), 1.55 (m, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.35 (m, 2H), 0.99 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

3.50 (m, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 2.25 (m, 2H), 1.99 (dd, J = 14.0, 3.0 Hz, 1H), 1.55 (dd, J = 14.0, 7.0 Hz, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.35 (m, 2H), 0.99 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

5 実施例 24 (38)

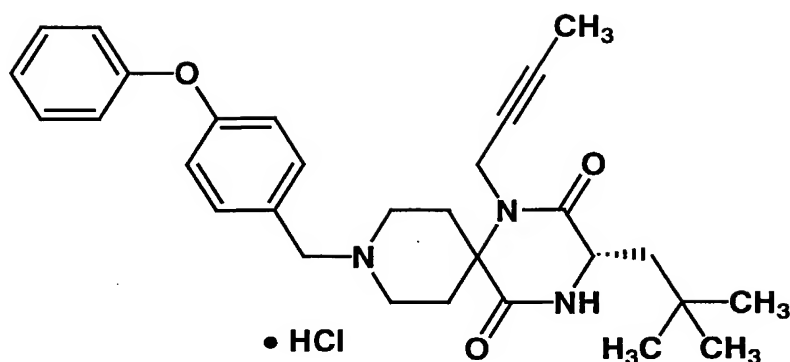
(3R) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2, 2-ジメチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



- 10 TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (brs, 2H), 4.33-4.09 (m, 2H), 4.03 (dd, J = 6.9, 3.3 Hz, 1H), 3.85-3.68 (m, 2H), 3.58-3.43 (m, 2H), 2.59-2.41 (m, 2H), 2.40-2.20 (m, 2H), 2.03 (dd, J = 14.4, 3.3 Hz, 1H), 1.75 (brs, 3H), 1.56 (dd, J = 14.4, 6.9 Hz, 1H), 0.99 (s, 9H)。

実施例 24 (39)

- (3S) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2, 2-ジメチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

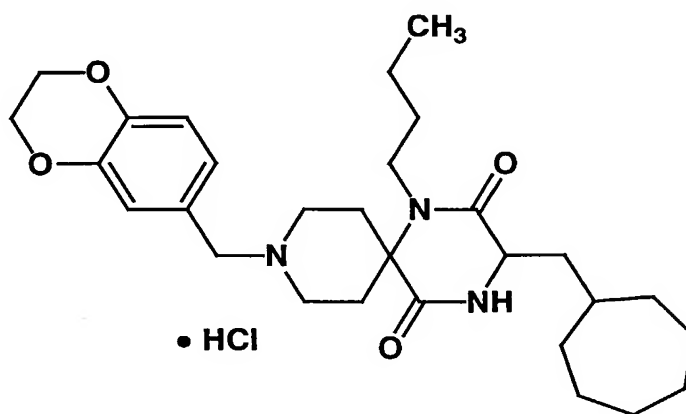


TLC : R f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (brs, 2H), 4.33-4.09 (m, 2H), 4.03 (dd, J = 6.9, 3.3 Hz, 1H), 3.85-3.68 (m, 2H), 3.58-3.43 (m, 2H), 2.59-2.41 (m, 2H), 2.40-2.20 (m, 2H), 2.03 (dd, J = 14.4, 3.3 Hz, 1H), 1.75 (brs, 3H), 1.56 (dd, J = 14.4, 6.9 Hz, 1H), 0.99 (s, 9H)。

実施例 24 (40)

- 10 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘプチルメチル-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



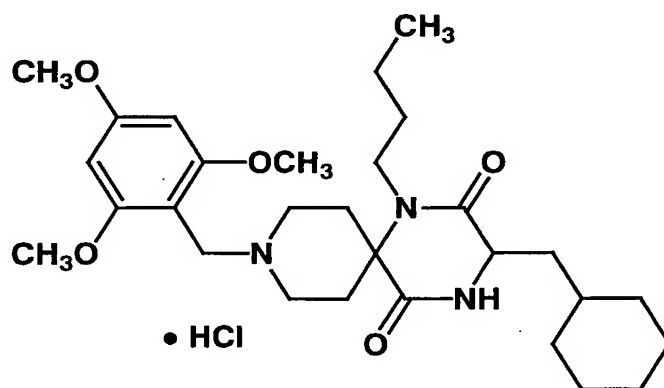
TLC : R f 0.70 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.24 (s, 2H), 3.99 (dd, J = 8.1, 4.2 Hz, 1H), 3.84-3.70 (m, 2H), 3.45 (m, 2H), 3.36 (m, 2H), 2.37-2.11 (m, 4H), 1.80-1.49 (m, 15H), 1.36 (m, 2H), 1.22 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

5

実施例 24 (41)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



10

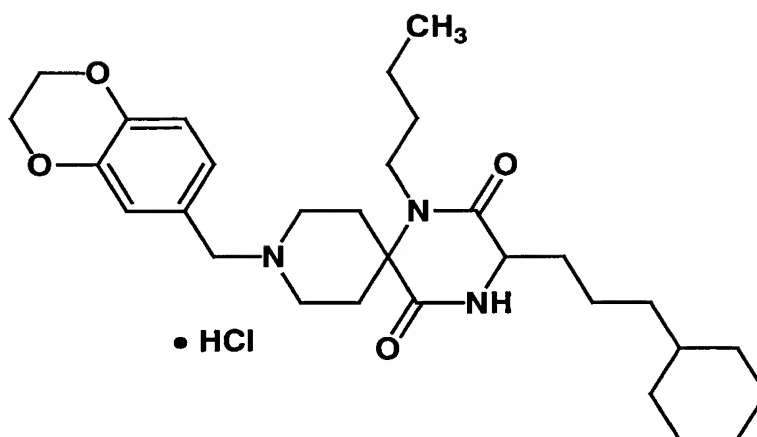
TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 6.31 (s, 2H), 4.26 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.89 (s, 6H), 3.84 (s, 3H), 3.84-3.73 (m, 2H), 3.54-3.33 (m, 4H), 2.44-2.25 (m, 2H), 2.24-2.03 (m, 2H), 1.84-1.12 (m, 15H), 1.06-0.85 (m, 5H)。

15

実施例 24 (42)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサ-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

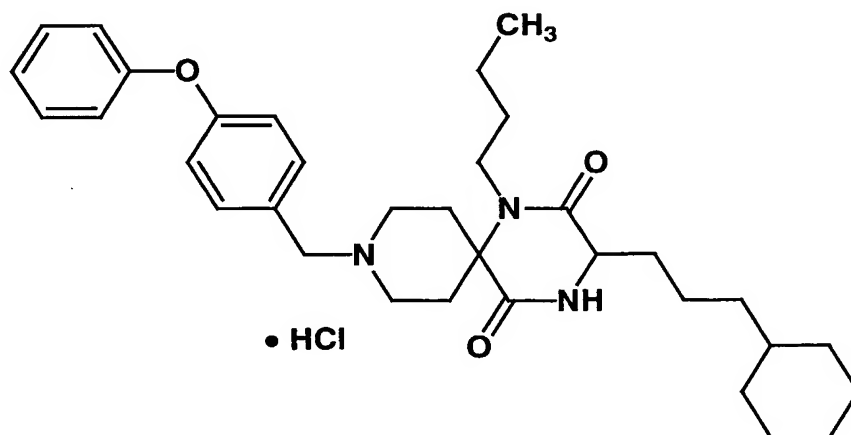


TLC : R_f 0.71 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.05-6.91 (m, 3H), 4.26 (s, 4H), 4.22 (s, 2H), 4.04 (t, J = 5.4 Hz, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.67 (m, 1H), 3.54-3.40 (m, 3H), 3.35 (m, 1H), 2.44-2.08 (m, 4H), 1.90-1.16 (m, 19H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 24 (43)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

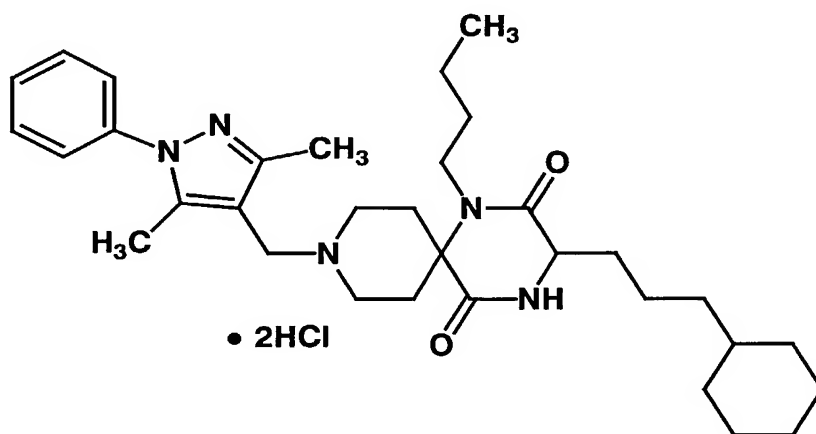


TLC : R_f 0.76 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53-7.49 (m, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.18 (m, 1H),
7.10-7.02 (m, 4H), 4.32 (s, 2H), 4.04 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 3.87 (m, 1H), 3.71 (m,
1H), 3.56-3.40 (m, 3H), 3.35 (m, 1H), 2.48-2.12 (m, 4H), 1.86-1.10 (m, 19H),
5 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 24 (44)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシルプロピル)-9
- (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,
10 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

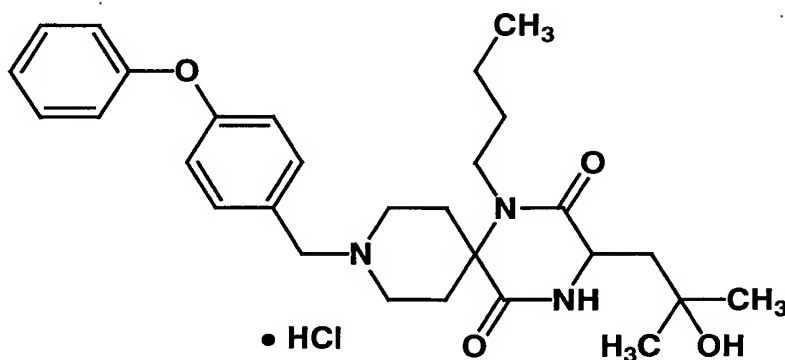


TLC : R_f 0.64 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.45 (m, 5H), 4.31 (s, 2H), 4.06 (t, J = 5.0 Hz, 1H), 3.92
(m, 1H), 3.77 (m, 1H), 3.63-3.37 (m, 4H), 2.44 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.38 (s,
15 3H), 2.21 (m, 2H), 1.85-1.68 (m, 7H), 1.54 (m, 2H), 1.39 (m, 4H), 1.23 (m, 6H),
0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.89 (m, 2H)。

実施例 24 (45)

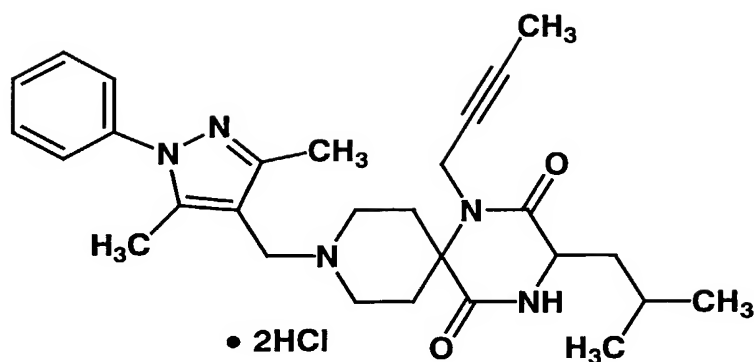
1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



- 5 TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 4H), 4.32 (brs, 2H), 4.29 (dd, J = 9.9, 3.0 Hz, 1H), 4.04-3.88 (m, 2H), 3.59-3.40 (m, 4H), 2.46-2.21 (m, 4H), 2.18 (dd, J = 14.4, 3.0 Hz, 1H), 1.75 (dd, J = 14.4, 9.9 Hz, 1H), 1.61-1.43 (m, 2H), 1.42-1.29 (m, 2H),
 10 1.28 (s, 6H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 24 (46)

- 1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,
 15 4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

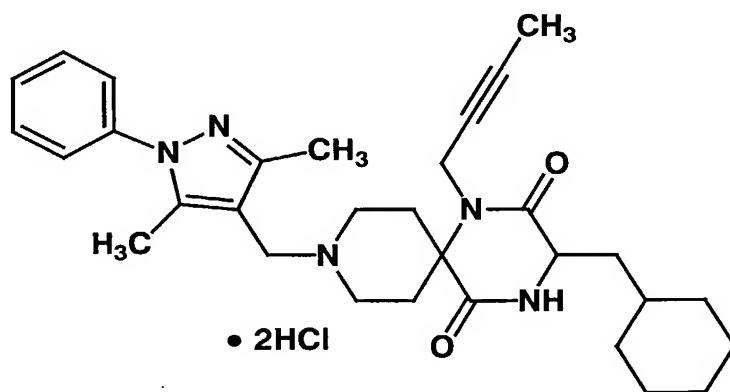


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.45 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.31-4.18 (m, 2H), 4.06 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.77 (m, 2H), 3.68-3.57 (m, 2H), 2.72-2.57 (m, 2H),
 5 2.40 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.36-2.16 (m, 2H), 1.92-1.59 (m, 6H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 24 (47)

1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9
 10 - (3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1,
 4, 9-トリアザスピロ[5, 5]ウンデカン・2塩酸塩



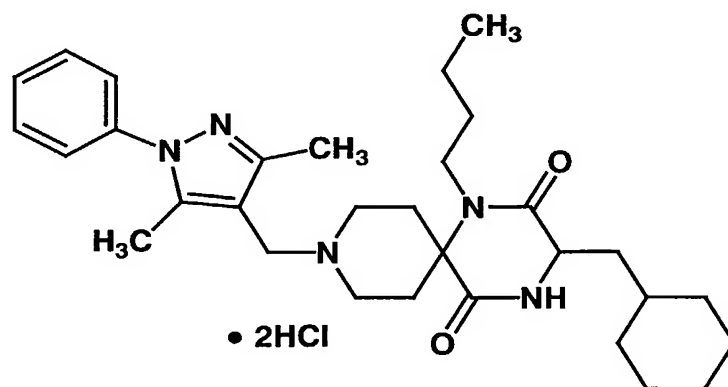
TLC : R_f 0.37 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : 7.60-7.43 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.23 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 4.09

(dd, $J = 7.2, 4.8$ Hz, 1H), 3.92-3.78 (m, 2H), 3.68-3.56 (m, 2H), 2.66-2.51 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.36-2.16 (m, 2H), 1.83-1.60 (m, 10H), 1.59-1.43 (m, 1H), 1.38-1.12 (m, 3H), 1.06-0.87 (m, 2H)。

5 実施例 24 (48)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

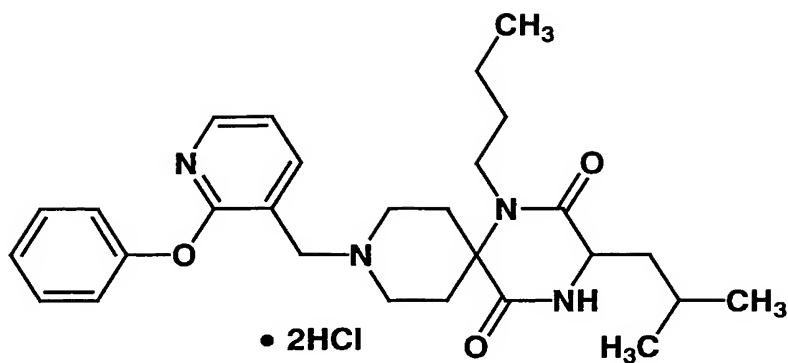


- 10 TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.63-7.48 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.05 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.95-3.74 (m, 2H), 3.67-3.56 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 2.72-2.58 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.30-2.07 (m, 2H), 1.84-1.10 (m, 15 H), 1.02-0.92 (m, 2H), 0.96 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

15

実施例 24 (49)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

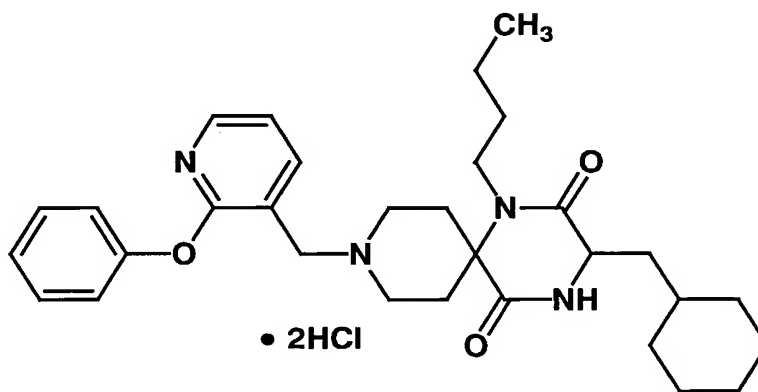


TLC : R_f 0.23 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.19 (m, 1H), 8.07 (m, 1H), 7.47-7.42 (m, 2H), 7.29-7.19 (m, 4H), 4.55 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.94 (m, 2H), 3.64 (m, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.54-2.16 (m, 4H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 24 (50)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



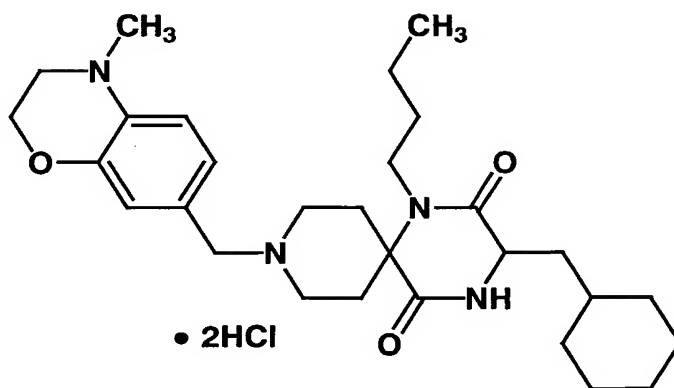
TLC : R_f 0.62 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.19 (m, 1H), 8.09 (m, 1H), 7.47-7.42 (m, 2H), 7.29-7.19 (m,

4H), 4.55 (s, 2H), 4.05 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.96 (m, 2H), 3.64 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.48 (m, 2H), 2.36-2.16 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.95-0.84 (m, 2H)。

5 実施例 24 (51)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルベンゾモルホリン-7-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

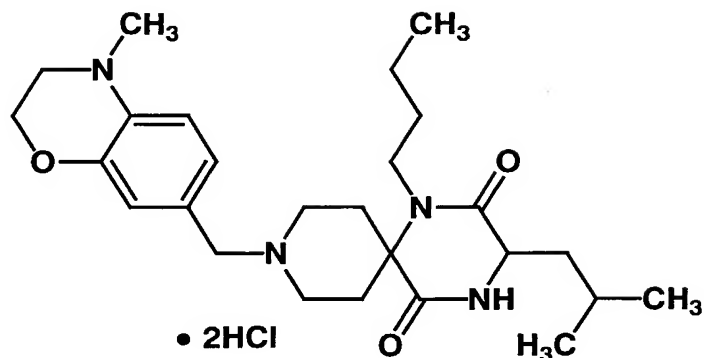


- 10 TLC: R_f 0.69 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;
 NMR (CDCl₃): δ 6.93 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 6.86 (s, 1H), 6.75 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 4.28-4.25 (m, 2H), 4.17 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.80-3.65 (m, 2H), 3.50-3.40 (m, 2H), 3.40-3.30 (m, 2H), 2.91 (s, 3H), 2.38-2.06 (m, 4H), 1.78-1.63 (m, 8H), 1.63-1.42 (m, 3H), 1.40-1.18 (m, 6H), 1.05-0.90 (m, 2H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。
- 15

実施例 24 (52)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチルベンゾモルホリン-7-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ

[5. 5] ウンデカン・2塩酸塩



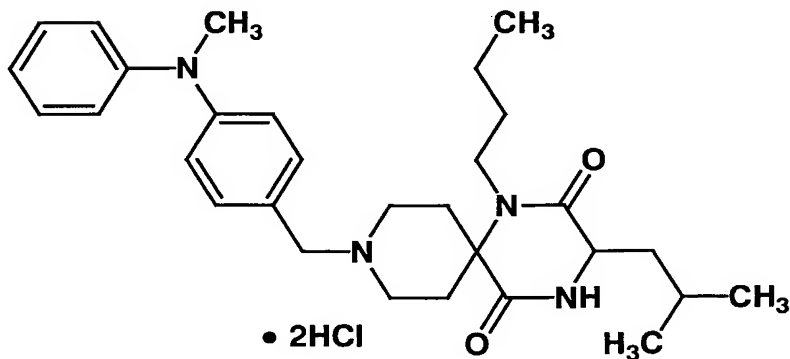
TLC : R f 0.56 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CDCl₃): δ 7.00 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 6.94 (s, 1H), 6.85 (d, J = 7.2 Hz, 1H),

5 4.31-4.29 (m, 2H), 4.19 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.79-3.66 (m, 2H), 3.47-3.34 (m, 6H), 2.97 (s, 3H), 2.45-2.34 (m, 2H), 2.22-2.10 (m, 2H), 1.84-1.75 (m, 1H), 1.71-1.46 (m, 4H), 1.42-1.32 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

实施例 24 (53)

10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(N-メチル-N-フェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリ
アザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



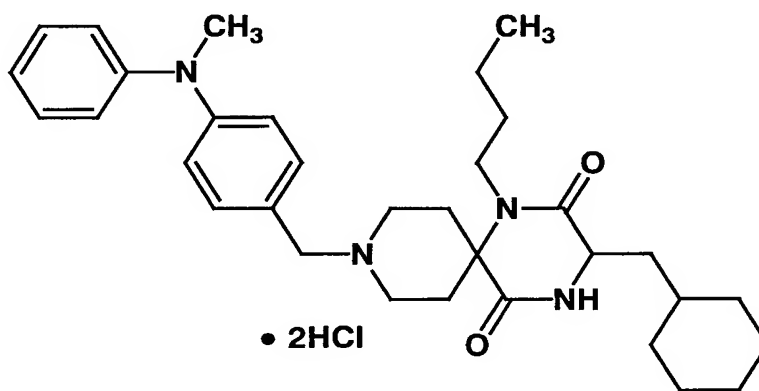
TLC : R_f 0.40 (クロロホルム：メタノール＝20：1)；

NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.28 (m, 4H), 7.19-7.10 (m, 3H), 6.94-6.86 (m, 2H), 4.23 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.63 (m, 2H), 3.55-3.30 (m, 4H), 3.31 (s, 3H), 2.46-2.27 (m, 2H), 2.26-2.06 (m, 2H), 1.90-1.42 (m, 5H), 1.44-1.26 (m, 2H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

5

実施例 2 4 (5 4)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(N-メチル-N-フェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



10

TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

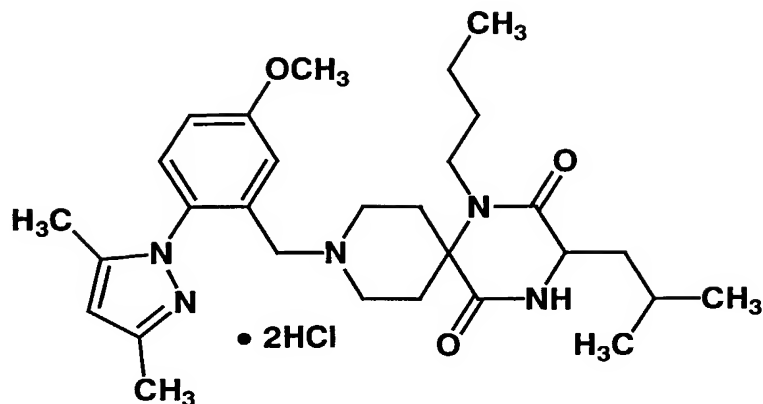
NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.28 (m, 4H), 7.20-7.12 (m, 3H), 6.93-6.86 (m, 2H), 4.24 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.85-3.66 (m, 2H), 3.55-3.40 (m, 2H), 3.40-3.30 (m, 2H), 3.32 (s, 3H), 2.44-2.07 (m, 4H), 1.84-1.40 (m, 10H), 1.40-1.10 (m, 5H), 1.06-0.85 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

15

実施例 2 4 (5 5)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル)-5-メトキシフェニルメチル)

－ 1, 4, 9－トリアザスピロ〔5. 5〕ウンデカン・2塩酸塩

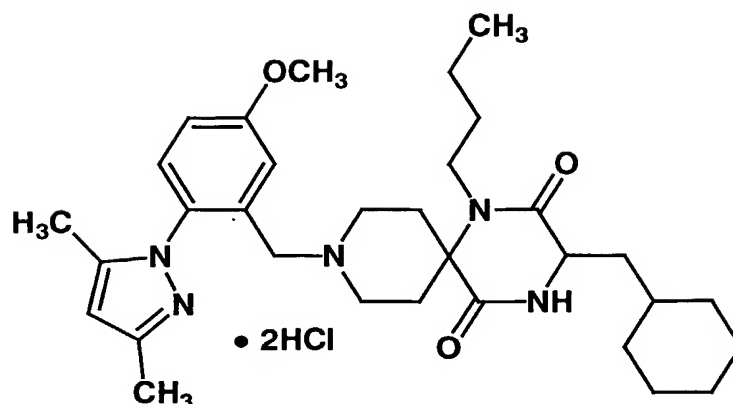


TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 8.7, 3.0 Hz, 1H), 6.29 (s, 1H), 4.09 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.74 (m, 2H), 3.42 (m, 4H), 2.44 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.22 (m, 2H), 1.86-1.30 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

10 実施例 24 (56)

1－ブチル－2, 5－ジオキソ－3－シクロヘキシルメチル－9－(2－(3, 5－ジメチルピラゾール－1－イル)－5－メトキシフェニルメチル)－1, 4, 9－トリアザスピロ〔5. 5〕ウンデカン・2塩酸塩

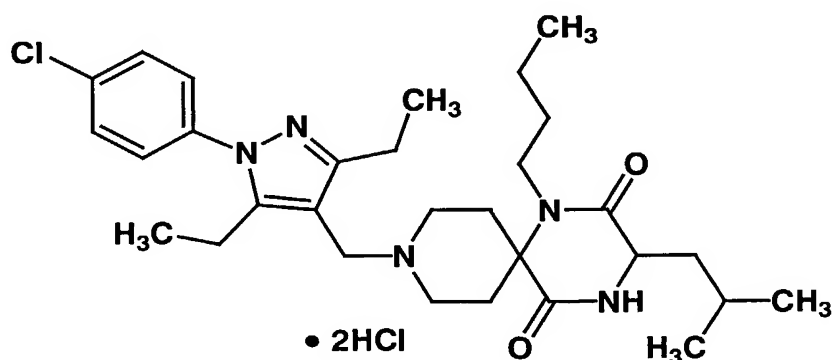


TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.43 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 8.7, 2.7 Hz, 1H), 6.22 (s, 1H), 4.09 (s, 2H), 4.06 (dd, J = 7.5, 4.2 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.80 (m, 2H), 3.42 (m, 4H), 2.38 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.20 (m, 2H), 1.80-1.16 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 24 (57)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジエチル-1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

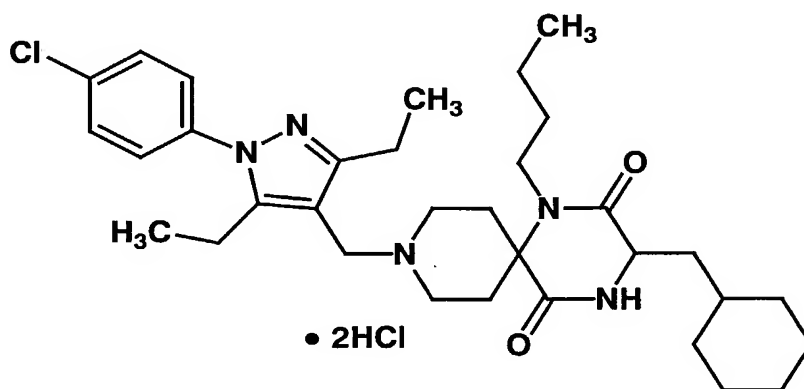
NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.49 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.31 (s,

2H), 4.02 (dd, $J = 7.8, 4.5$ Hz, 1H), 3.94-3.73 (m, 2H), 3.65-3.54 (m, 2H), 3.49-3.38 (m, 2H), 2.88 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.77 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.58-2.38 (m, 2H), 2.30-2.12 (m, 2H), 1.90-1.56 (m, 5H), 1.55-1.30 (m, 2H), 1.31 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.99-0.94 (m, 12H)。

5

実施例 24 (58)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジエチル-1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



10

TLC : Rf 0.51 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

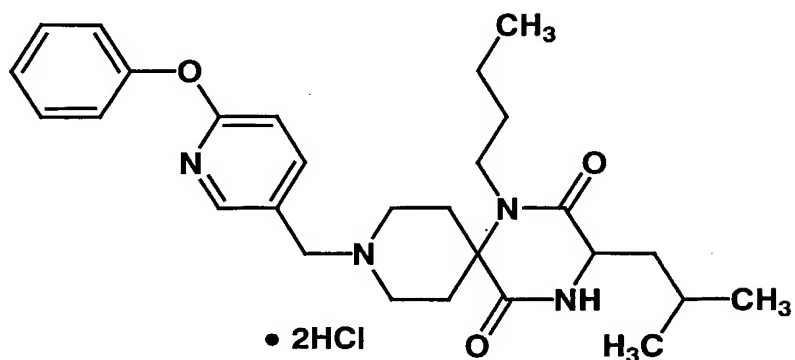
NMR (CD₃OD) : δ 7.58 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.48 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.05 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.94-3.73 (m, 2H), 3.65-3.54 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 2H), 2.88 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.77 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 2.60-2.40 (m, 2H), 2.28-2.09 (m, 2H), 1.85-1.10 (m, 15H), 1.31 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.04-0.85 (m, 2H), 0.96 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 0.94 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H)。

15

実施例 24 (59)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-

フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ
[5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



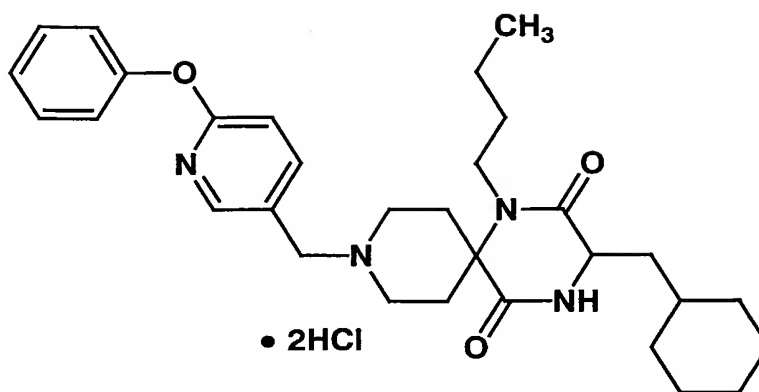
TLC : R_f 0.65 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 8.32 (s, 1H), 8.06 (m, 1H), 7.44 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.26 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.39 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.53-3.41 (m, 4H), 2.45 (m, 2H), 2.25-2.12 (m, 2H), 1.78 (m, 1H), 1.72-1.50 (m, 4H), 1.36 (m, 2H), 0.97-0.93 (m, 9H)。

10

実施例 24 (60)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(6-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

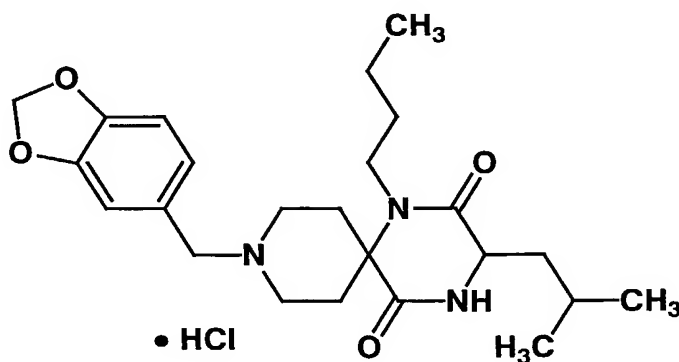


TLC : R_f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.31 (s, 1H), 8.07 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.26 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.06 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.39 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.6 Hz, 1H), 3.90-3.76 (m, 2H), 3.52-3.38 (m, 4H), 2.58-2.36 (m, 2H), 2.25-2.11 (m, 2H), 1.80-1.42 (m, 10H), 1.42-1.17 (m, 5H), 1.05-0.85 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 24 (61)

- 10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



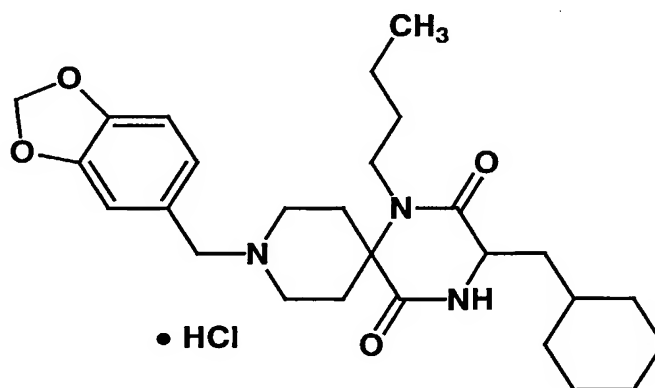
TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.05-7.00 (m, 2H), 6.92 (m, 1H), 6.03 (s, 2H), 4.26 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 4H), 2.42-2.10 (m, 4H), 1.88-1.32 (m, 7H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

5

実施例 2 4 (6 2)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1, 3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

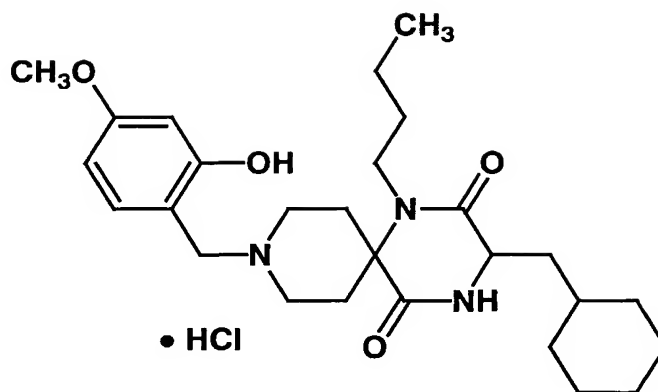
TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.06-7.01 (m, 2H), 6.92 (m, 1H), 6.03 (s, 2H), 4.27 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.82-3.70 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.48-2.10 (m, 4H), 1.82-1.16 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

15

実施例 2 4 (6 3)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

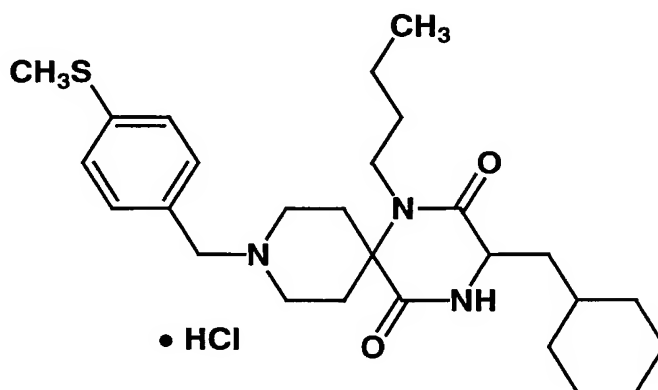


TLC : R_f 0.88 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.26 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 6.51 (dd, J = 8.5, 2.5 Hz, 1H), 6.48 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.26 (s, 2H), 4.03 (m, 1H), 3.77 (m, 5H), 3.47 (m, 2H), 3.37 (m, 2H), 2.34 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 1.69 (m, 6H), 1.52 (m, 4H), 1.31 (m, 5H), 0.95 (m, 5H)。

実施例 24 (64)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルチオフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

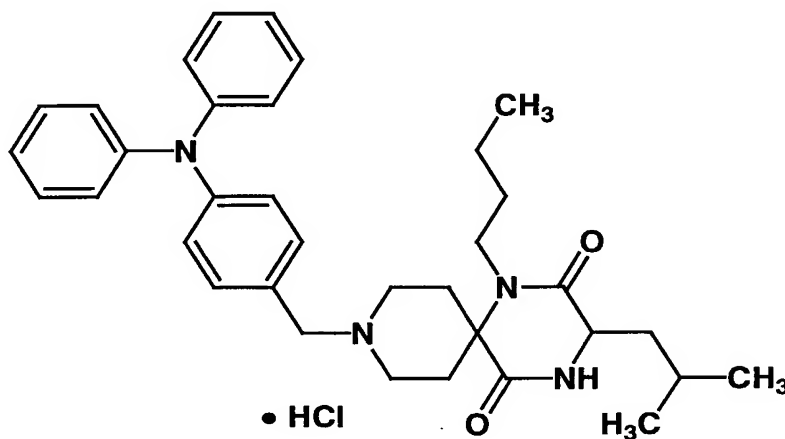


TLC : R_f 0.83 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.44 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 3.49 (m, 2H), 3.34 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.36-2.11 (m, 4H), 1.69 (m, 10H), 1.39-1.23 (m, 5H), 0.95 (m, 5H)。

5 実施例 2 4 (6 5)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(N,N-ジフェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



10 TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

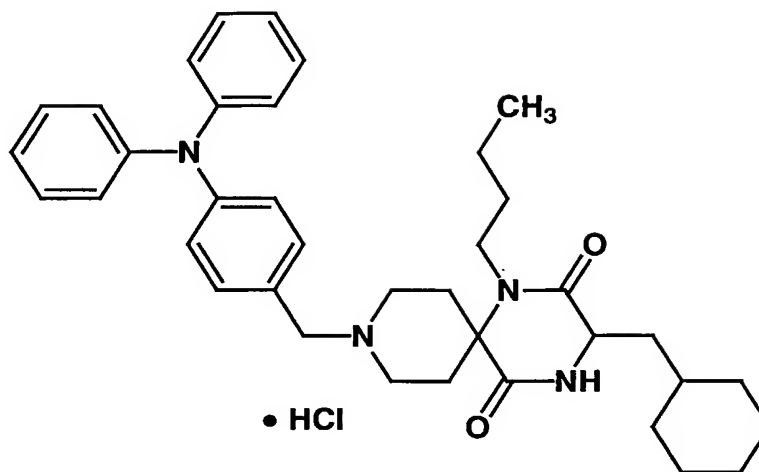
NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.25 (m, 6H), 7.13-7.01 (m, 8H), 4.27 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.87-3.68 (m, 2H), 3.56-3.44 (m, 2H), 3.44-3.32 (m, 2H), 2.48-2.32 (m, 2H), 2.29-2.10 (m, 2H), 1.90-1.44 (m, 5H), 1.44-1.30 (m, 2H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

15

実施例 2 4 (6 6)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(N,N-ジフェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

5] ウンデカン・塩酸塩

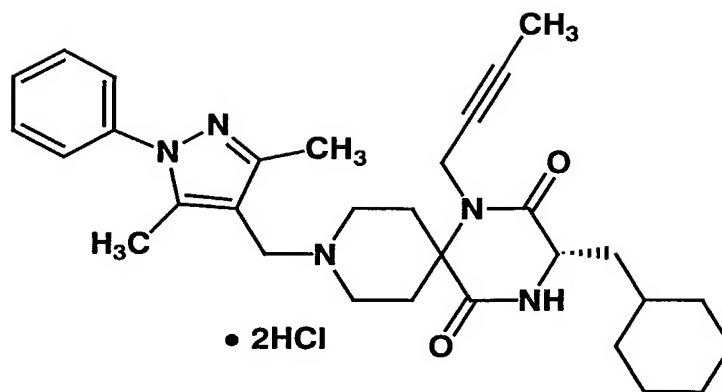


TLC : R_f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.41-7.26 (m, 6H), 7.14-7.00 (m, 8H), 4.27 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.57-3.45 (m, 2H), 3.44-3.36 (m, 2H), 2.48-2.32 (m, 2H), 2.28-2.07 (m, 2H), 1.84-1.44 (m, 10H), 1.44-1.14 (m, 5H), 1.00-0.90 (m, 2H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H)。

実施例 24 (67)

- 10 (3S) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシル
メチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチ
ル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2塩酸塩

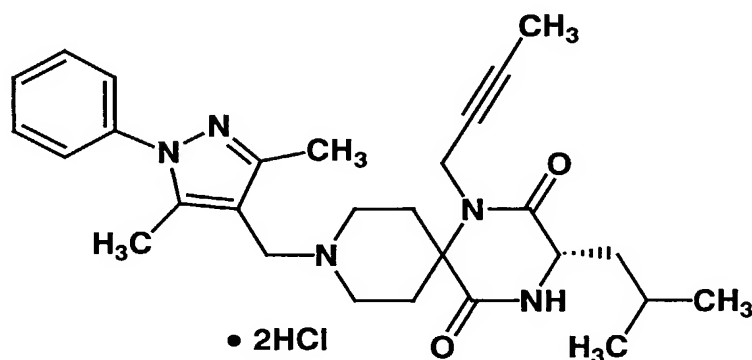


TLC : R_f 0.32 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.46 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.24 (s, 2H), 4.09 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86 (m, 2H), 3.65 (m, 2H), 2.60 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 1.88-1.66 (m, 10H), 1.53 (m, 1H), 1.25 (m, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 24 (68)

(3S) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル - 1-フェニルピラゾール - 4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2塩酸塩



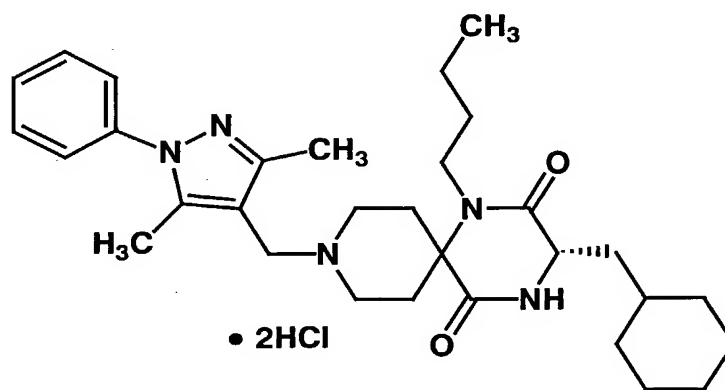
TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.46 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.26 (m, 2H), 4.06 (dd, J =

7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 2.60 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.27 (m, 2H), 1.89-1.61 (m, 6H), 0.95 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

5 実施例 24 (69)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

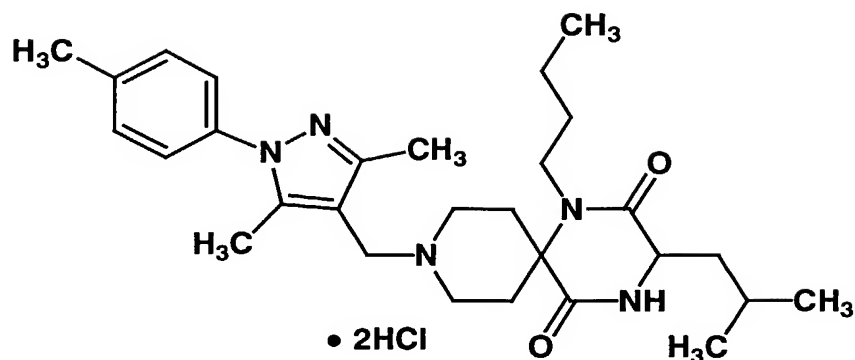


- 10 TLC : R_f 0.57 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.45 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.06 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.43 (m, 2H), 2.53-2.44 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.32-2.16 (m, 2H), 1.80-1.17 (m, 15H), 1.02-0.93 (m, 2H), 0.96 (d, J = 7.0 Hz, 3H)。

15

実施例 24 (70)

1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

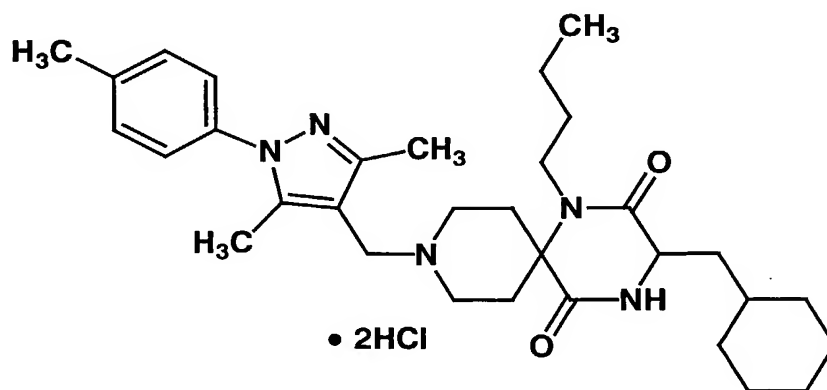


TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.36 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.31 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.38 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.52-2.18 (m, 4H), 1.90-1.32 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 24 (71)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3,5-ジメチル-1-(4-メチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



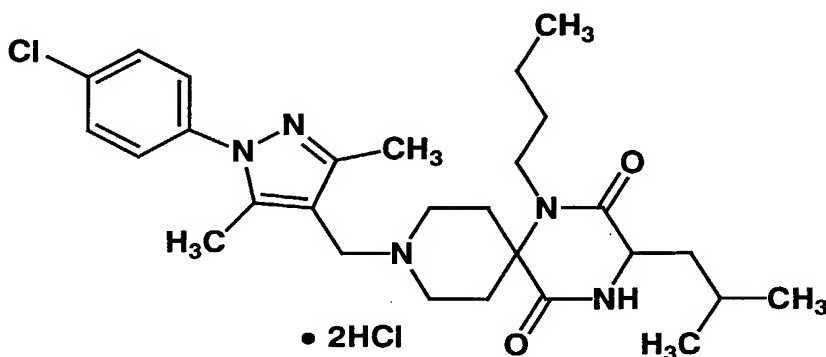
TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.38 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.33 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.31 (s,

2H), 4.06 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.82 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.56-2.14 (m, 3H), 1.84-1.16 (m, 15H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.97 (m, 2H)。

5 実施例 2 4 (7 2)

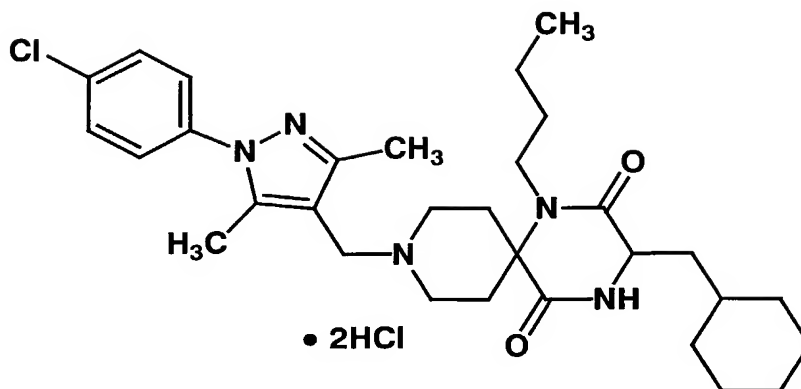
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



- 10 TLC : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.49 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.91-3.80 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.46 (m, 2H), 2.52 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.27-2.15 (m, 2H), 1.86-1.81 (m, 1H), 1.76-1.51 (m, 4H), 1.44-1.32 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.0 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.0 Hz, 3H)。

実施例 2 4 (7 3)

- 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

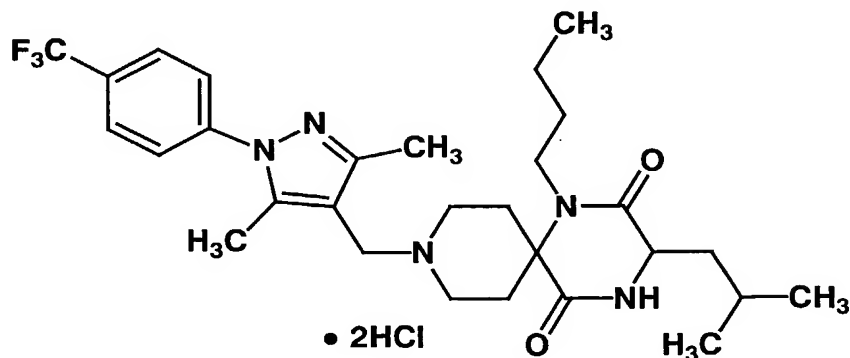


TLC : R_f 0.27 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.48 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.91-3.77 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.45 (m, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.39 (s, 6H), 2.27-2.14 (m, 2H), 1.80-1.51 (m, 9H), 1.44-1.17 (m, 6H), 1.03-0.89 (m, 5H)。

実施例 24 (74)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

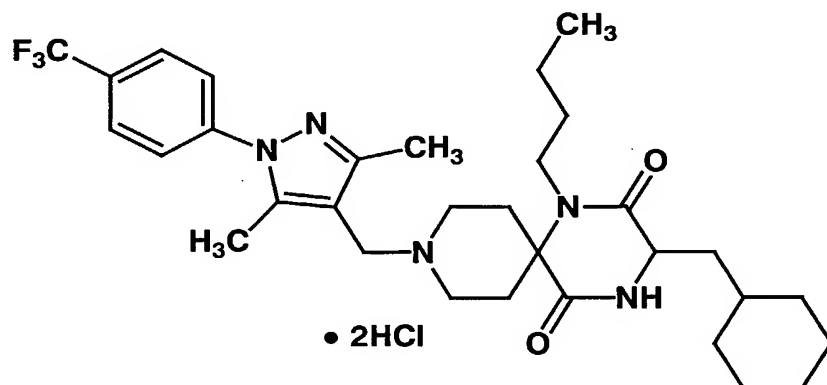


TLC : R_f 0.23 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.87 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.72 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.78 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.43 (m, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.29-2.16 (m, 2H), 1.86-1.77 (m, 1H), 1.74-1.54 (m, 4H), 1.44-1.34 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.0 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.0 Hz, 3H)。

実施例 24 (75)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



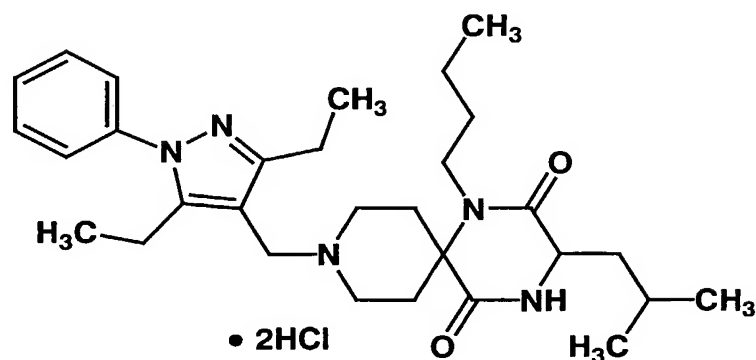
TLC : R_f 0.37 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.87 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.72 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.78 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.45 (m, 2H), 2.50 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.28-2.15 (m, 2H), 1.80-1.51 (m, 9H), 1.44-1.21 (m, 6H), 1.03-0.93 (m, 5H)。

実施例 24 (76)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3,

5-ジエチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-
トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

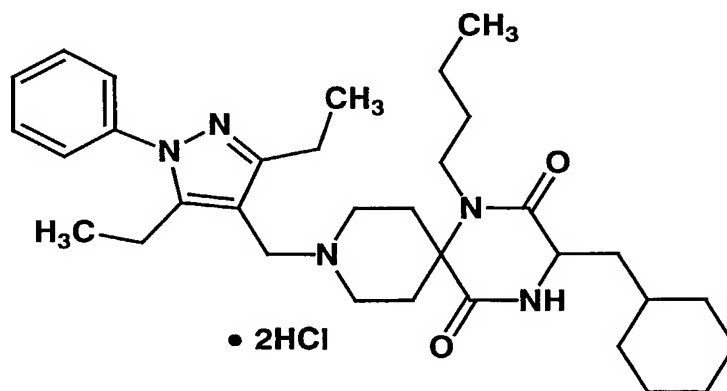


TLC: R_f 0.70 (クロロホルム:メタノール=10:1);

- 5 NMR (CD₃OD): δ 7.61-7.53 (m, 3H), 7.53-7.46 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.79 (m, 2H), 3.65-3.58 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 2H), 2.85-2.75 (m, 4H), 2.47 (br, 2H), 2.28-2.16 (m, 2H), 1.83-1.46 (m, 3H), 1.41-1.29 (m, 4H), 0.98-0.91 (m, 15H)。

10 実施例 24 (77)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3,5-
ジエチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-ト
リアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



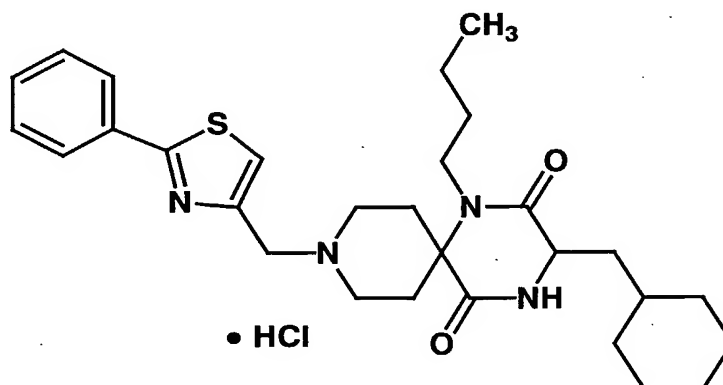
TLC : R_f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.53 (m, 3H), 7.53-7.46 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.79 (m, 2H), 3.70-3.55 (m, 2H), 3.47-3.31 (m, 2H), 2.91-2.75 (m, 4H), 2.60-2.45 (m, 2H), 2.30-2.14 (m, 2H), 1.80-1.43 (m, 9H),
 5 1.43-1.15 (m, 8H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

実施例 24 (78)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-フェニルチアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.

10 5] ウンデカン・塩酸塩



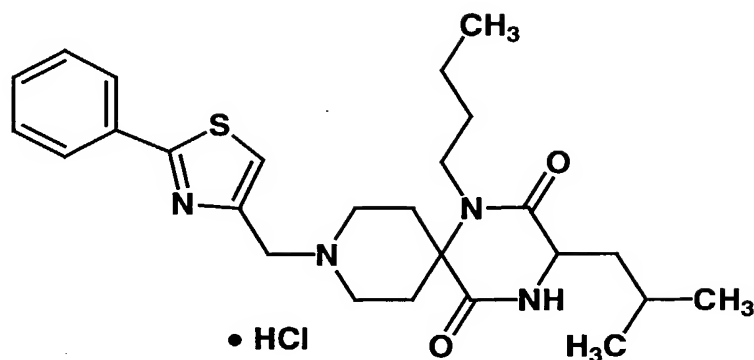
TLC : R_f 0.62 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.03-8.00 (m, 2H), 7.87 (s, 1H), 7.52-7.49 (m, 3H), 4.54 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.6, 4.8 Hz, 1H), 4.04-3.87 (m, 2H), 3.70-3.58 (m, 2H), 3.51-
 15 3.39 (m, 2H), 2.58-2.38 (m, 2H), 2.26-2.13 (m, 2H), 1.78-1.43 (m, 9H), 1.40-1.15 (m, 6H), 1.10-0.90 (m, 5H)。

実施例 24 (79)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-

フェニルチアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

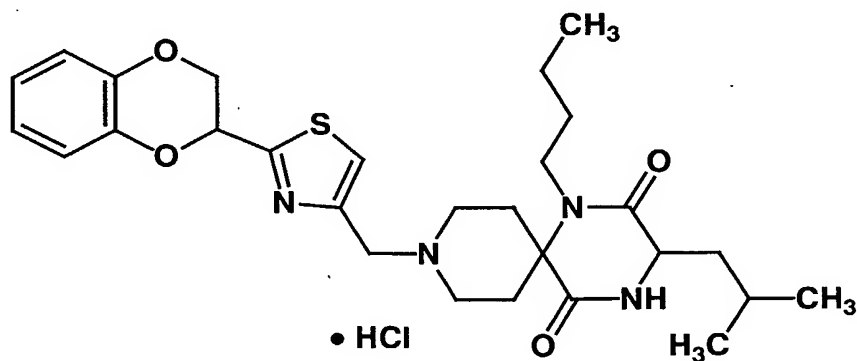


TLC: R_f 0.38 (クロロホルム:メタノール=10:1);

- 5 NMR (CD₃OD): δ 8.02-8.01 (m, 2H), 7.85 (s, 1H), 7.51-7.50 (m, 3H), 4.55 (s, 2H), 4.03-3.86 (m, 3H), 3.68-3.59 (m, 2H), 3.45-3.36 (m, 2H), 2.50-2.34 (m, 2H), 2.29-2.16 (m, 2H), 1.88-1.45 (m, 5H), 1.36 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 0.97-0.93 (m, 9H).

実施例 24 (80)

- 10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(1, 4-ベンゾジオキサン-2-イル)チアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

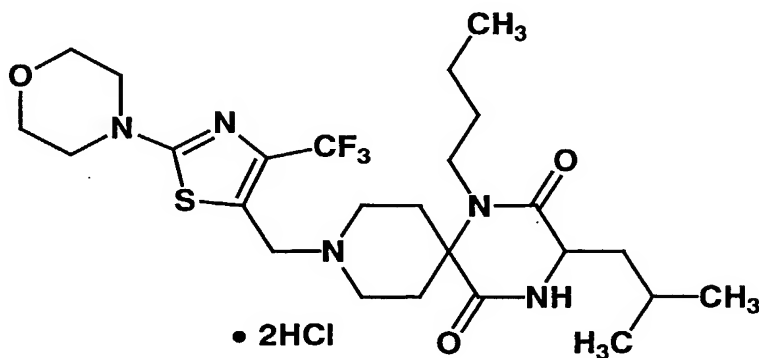


TLC: R_f 0.36 (クロロホルム:メタノール=10:1);

NMR (CD₃OD) : δ 7.88 (s, 1H), 7.00 (m, 1H), 6.94-6.87 (m, 3H), 5.66 (dd, J = 6.0, 2.7 Hz, 1H), 4.62 (dd, J = 11.7, 2.7 Hz, 1H), 4.51 (s, 2H), 4.42 (dd, J = 11.7, 6.0 Hz, 1H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88 (m, 2H), 3.58 (m, 2H), 3.40 (m, 2H), 2.48-2.16 (m, 4H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 2 4 (8 1)

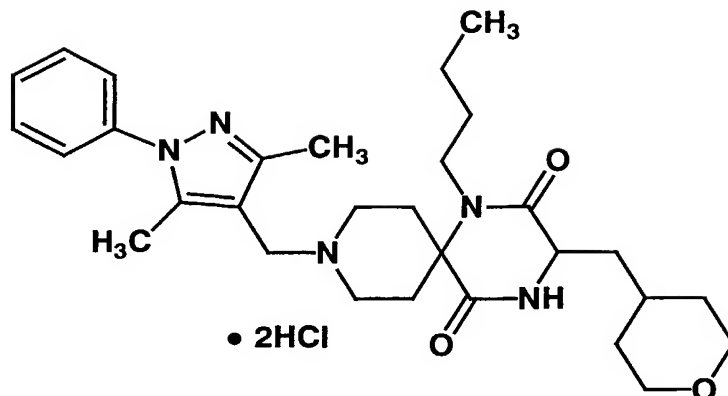
1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-トリフルオロメチル-2-(モルホリン-1-イル)チアゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩



TLC : R_f 0.78 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 4.63 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.78 (m, 6H), 3.58 (m, 6H), 3.40 (m, 2H), 2.44 (m, 2H), 2.22 (m, 2H), 1.88-1.32 (m, 8H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 2 4 (8 2)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(テトラヒドロピラン-4-イルメチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

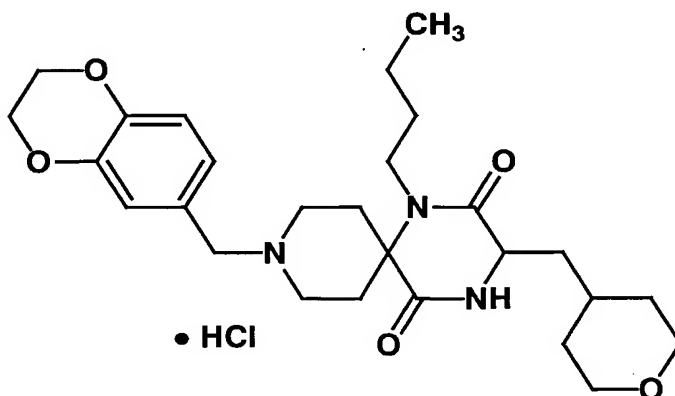


TLC : R_f 0.31 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.46 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.09 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.98 - 3.78 (m, 4H), 3.68 - 3.56 (m, 2H), 3.50 - 3.36 (m, 4H), 2.58-2.16 (m, 4H), 2.40 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.84-1.20 (m, 11H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 24 (83)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(テトラヒドロピラン-4-イルメチル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-
10 トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



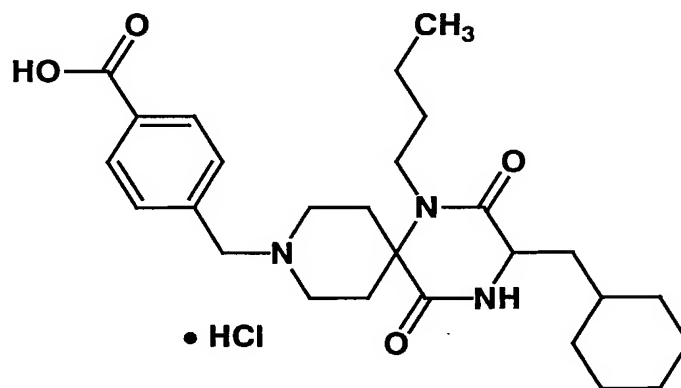
TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.06-6.92 (m, 3H), 4.27 (s, 4H), 4.24 (s, 2H), 4.07 (dd, J =

7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96 - 3.86 (m, 2H), 3.84 - 3.68 (m, 2H), 3.52 - 3.36 (m, 6H), 2.44-2.10 (m, 4H), 1.82-1.22 (m, 11H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 2 4 (8 4)

- 5 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-カルボキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

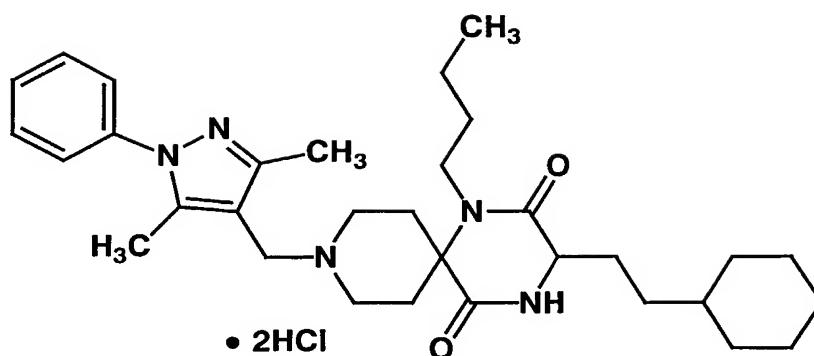


TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 2 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 8.14 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.68 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.45 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.76 (m, 2H), 3.56-3.43 (m, 2H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.50-2.31 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.84-1.12 (m, 15H), 1.06-0.90 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

15 実施例 2 4 (8 5)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-シクロヘキシルエチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

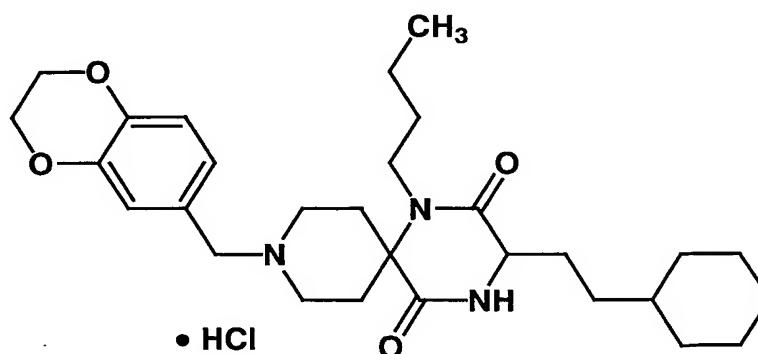


TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.56-7.45 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (t, J = 4.8 Hz, 1H),
 3.98-3.85 (m, 1H), 3.85-3.70 (m, 1H), 3.65-3.56 (m, 2H), 3.56-3.42 (m, 1H),
 5 3.42-3.30 (m, 1H), 2.55-2.37 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.30-2.13 (m,
 2H), 1.92-1.78 (m, 2H), 1.78-1.60 (m, 5H), 1.60-1.48 (m, 2H), 1.48-1.32 (m, 2H),
 1.32-1.08 (m, 6H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96-0.85 (m, 2H)。

実施例 24 (86)

10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-シクロヘキシルエチル)-9-(
 (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザス
 ピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

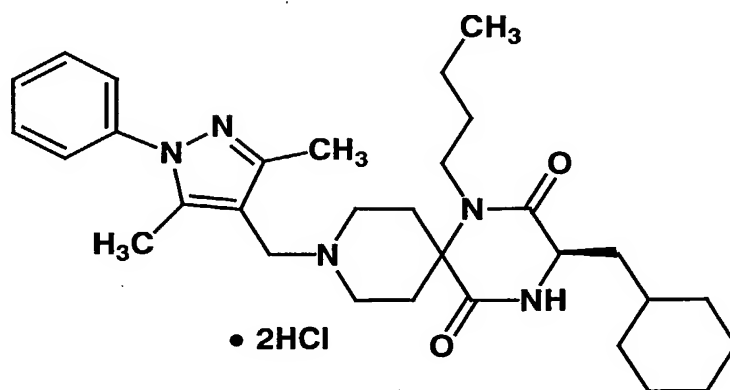
15 NMR (CD₃OD) : δ 7.05 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92

(d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.03 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 3.90-3.79 (m, 1H), 3.76-3.62 (m, 1H), 3.50-3.38 (m, 3H), 3.38-3.30 (m, 1H), 2.43-2.06 (m, 4H), 1.92-1.78 (m, 2H), 1.78-1.60 (m, 5H), 1.60-1.45 (m, 2H), 1.42-1.30 (m, 2H), 1.30-1.08 (m, 6H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.97-0.88 (m, 2H)。

5

実施例 24 (87)

(3R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩酸塩



10

TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

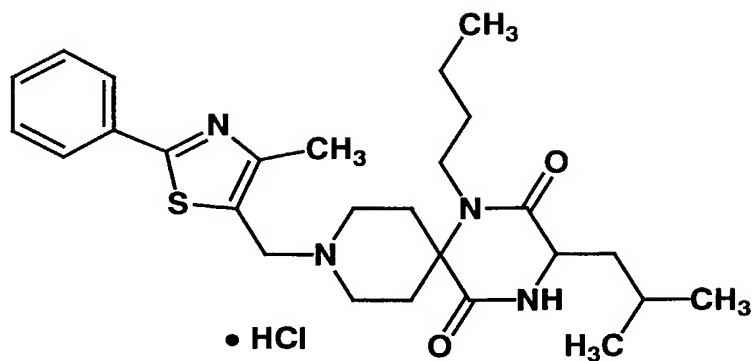
NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.48 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.06 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.95 - 3.78 (m, 2H), 3.68 - 3.58 (m, 2H), 3.50 - 3.40 (m, 2H), 2.62 - 2.45 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.30 - 2.12 (m, 2H), 1.82-1.12 (m, 15H), 0.97 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.97 (m, 2H)。

15

実施例 24 (88)

1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - メチル - 2 - フェニルチアゾール - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリア

ザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

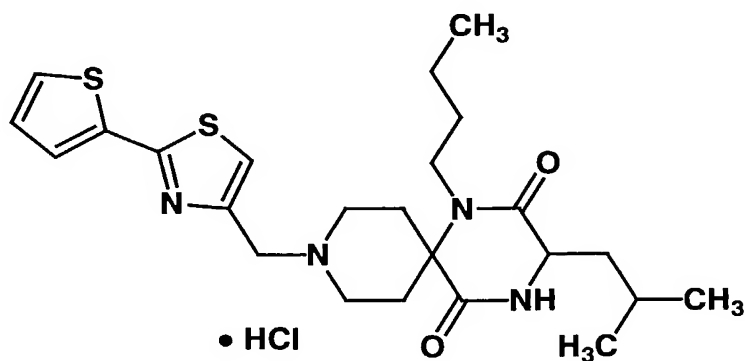


TLC : R_f 0.75 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.98-7.95 (m, 2H), 7.55-7.50 (m, 3H), 4.69 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.78 (m, 2H), 3.65-3.56 (m, 2H), 3.50-3.40 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 2.60-2.48 (m, 2H), 2.27-2.14 (m, 2H), 1.88-1.48 (m, 5H), 1.48-1.30 (m, 2H), 0.97-0.93 (m, 9H)。

実施例 24 (89)

- 10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(チオフェン-1-イル)チアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



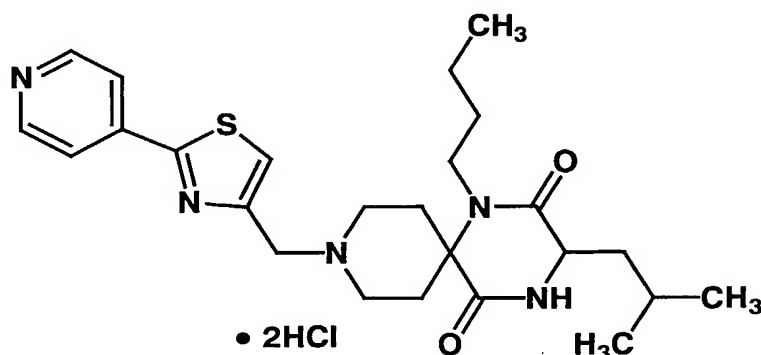
TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.81 (s, 1H), 7.67 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.14 (dd, J = 5.4, 3.9 Hz, 1H), 4.49 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.82 (m, 2H), 3.62-3.55 (m, 2H), 3.42 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.86-1.42 (m, 5H), 1.46-1.30 (m, 2H), 0.97-0.93 (m, 9H)。

5

実施例 24 (90)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(ピリジン-4-イル)チアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリ
アザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



10

TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

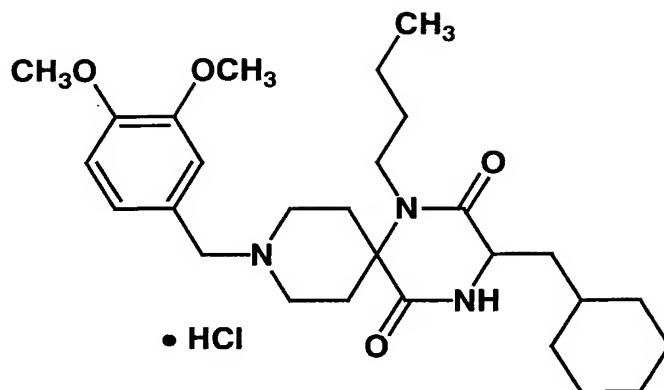
NMR (CD₃OD) : δ 8.98 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 8.71 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 8.37 (s, 1H), 4.66 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 4.00-3.87 (m, 2H), 3.70-3.59 (m, 2H), 3.50 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 2.72-2.58 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.88-1.46 (m, 5H), 1.46-1.35 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

15

実施例 24 (91)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 4-ジメトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウ
ンデカン・塩酸塩

20

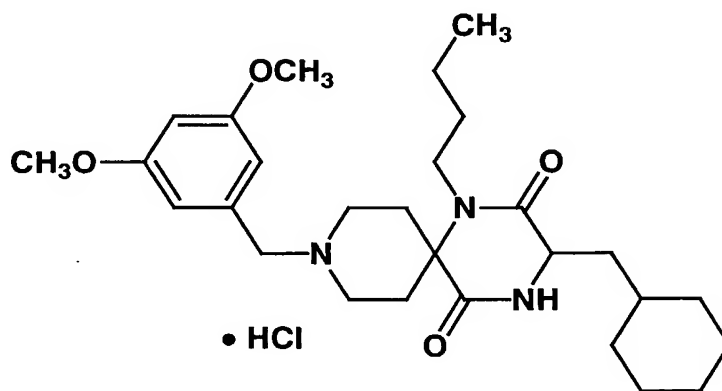


TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.23 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.29 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 3.88-3.64 (m, 2H), 3.56-3.38 (m, 4H), 2.58-2.37 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 24 (92)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3,5-ジメトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



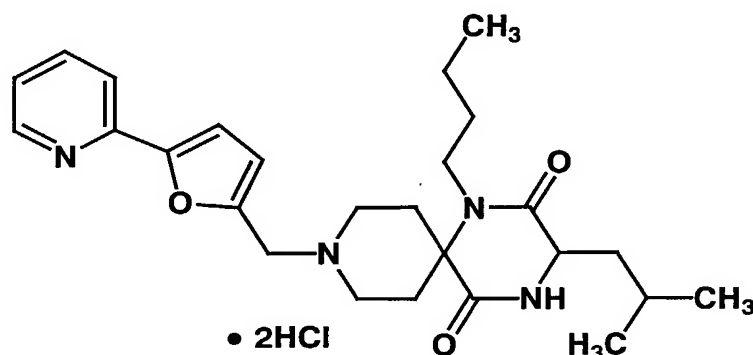
TLC : R_f 0.31 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 6.74 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 6.60 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 4.28 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.70 (m, 2H), 3.83 (s, 6H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.52-2.36 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

5

実施例 2 4 (9 3)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ピリジン-2-イル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2 塩酸塩



10

TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.76 (dd, J = 5.4, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (ddd, J = 8.1, 7.5, 1.5 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.85 (dd, J = 8.1, 5.4 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.63 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.81 (m, 2H), 3.65-3.55 (m, 2H), 3.49 (t, J = 8.1 Hz, 2H), 2.72-2.55 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.90-1.27 (m, 7H), 1.00-0.89 (m, 9H)。

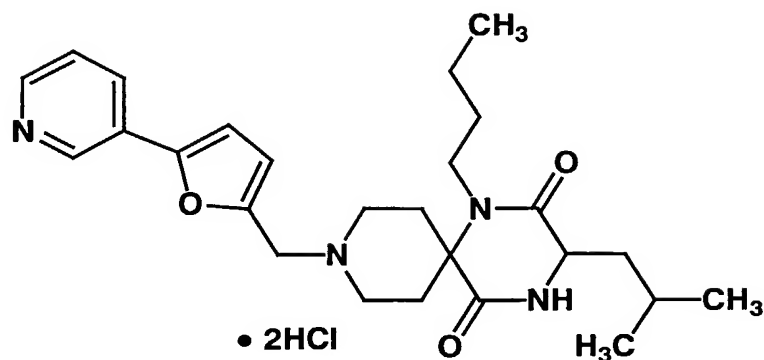
15

実施例 2 4 (9 4)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ピリジン-3-イル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザ

20

スピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

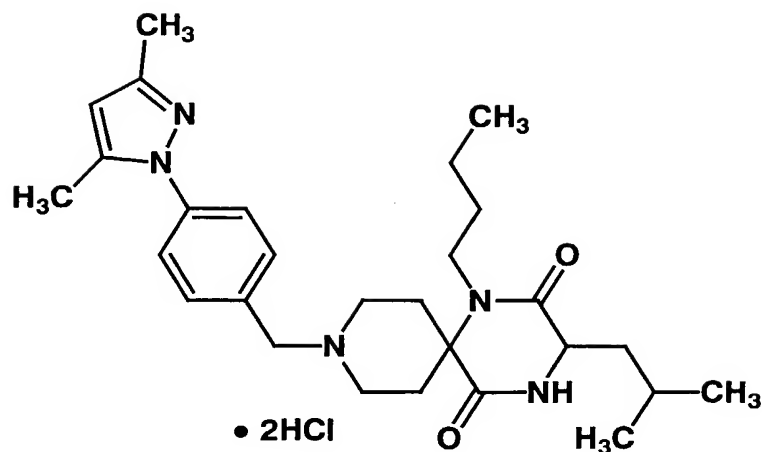


TLC : R_f 0.45 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 9.34 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.94 (dd, J = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 8.10 (dd, J = 8.1, 5.4 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.57 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.77 (m, 2H), 3.63-3.43 (m, 4H), 2.73-2.55 (m, 2H), 2.28-2.09 (m, 2H), 1.89-1.27 (m, 7H), 1.00-0.89 (m, 9H)。

10 実施例 24 (95)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

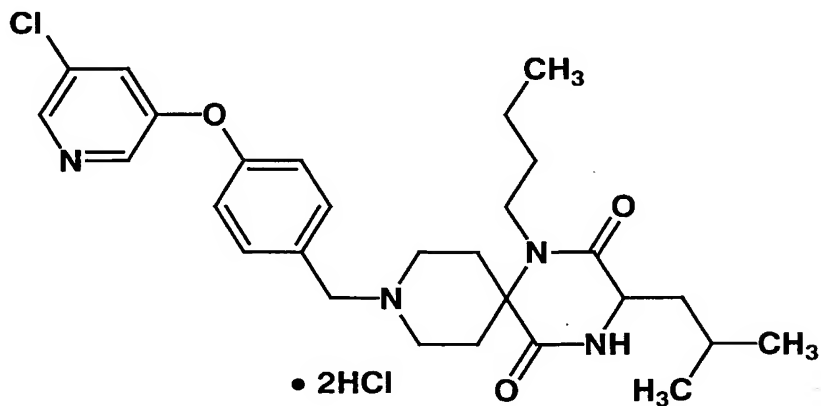


TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.94 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.71 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 6.51 (s, 1H), 4.49 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.85-3.76 (m, 2H), 3.58-3.48 (m, 4H), 2.72-2.58 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.23-2.06 (m, 2H), 1.88-1.45 (m, 5H), 1.45-1.34 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 24 (96)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(5-クロロピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

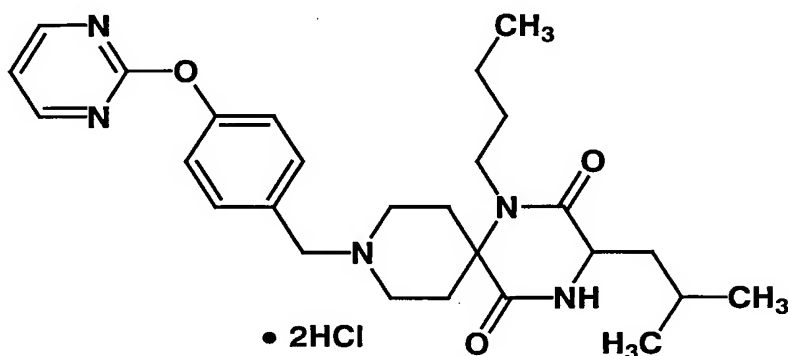


TLC : R_f 0.57 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.54 (bs, 1H), 8.45 (bs, 1H), 7.87 (bs, 1H), 7.71 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.26 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H),
 5 3.90-3.73 (m, 2H), 3.56-3.40 (m, 4H), 2.64-2.46 (m, 2H), 2.24-2.09 (m, 2H),
 1.86-1.42 (m, 5H), 1.42-1.30 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 24 (97)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザ
 10 スピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



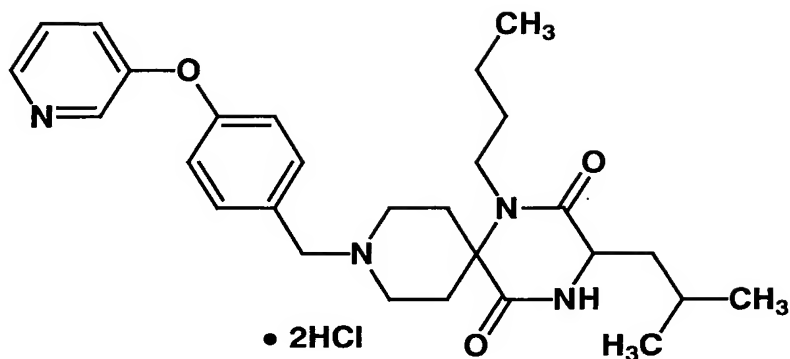
TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.62 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 7.68 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.26 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 4.40 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H),
 15 3.93-3.72 (m, 2H), 3.60-3.35 (m, 4H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.28-2.07 (m, 2H),
 1.90-1.45 (m, 5H), 1.45-1.36 (m, 2H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

実施例 24 (98)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザ
 20 スピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

ピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

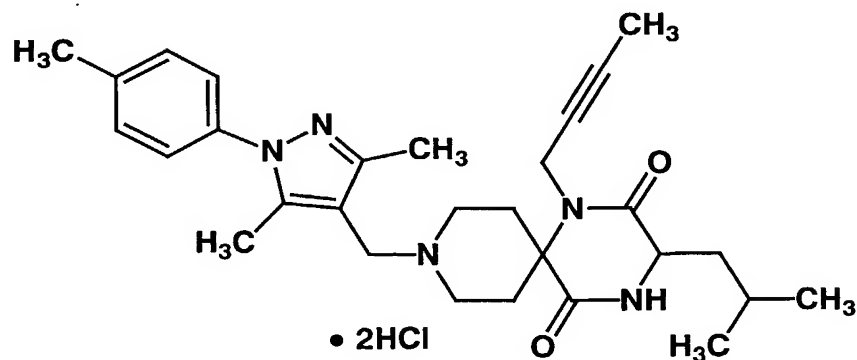


TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.76 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 8.28 (dd, J = 8.7, 2.7 Hz, 1H), 8.07 (dd, J = 8.7, 5.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.35 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.72 (m, 2H), 3.58-3.40 (m, 4H), 2.68-2.48 (m, 2H), 2.26-2.06 (m, 2H), 1.90-1.46 (m, 5H), 1.46-1.30 (m, 2H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

10 実施例 24 (99)

1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



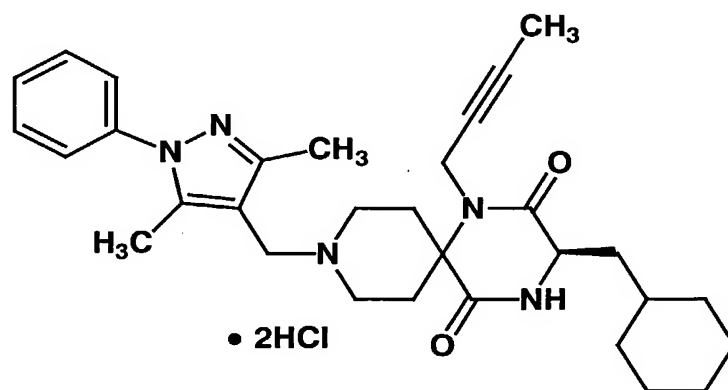
TLC : Rf 0.28 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.39-7.29 (m, 4H), 4.31 (s, 2H), 4.27-4.20 (m, 2H), 4.06 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.84 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 2.59 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.28 (m, 2H), 1.92-1.60 (m, 6H), 0.96 (d, J = 6.3 Hz, 3H),

5 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 24 (100)

(3R) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ - 3-シクロヘキシル
メチル - 9 - (3, 5-ジメチル - 1-フェニルピラゾール - 4-イルメチ
10 ル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



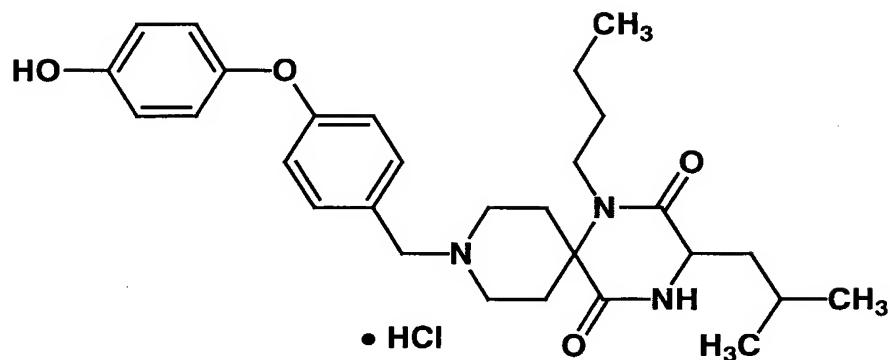
TLC : Rf 0.29 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.43 (m, 5H), 4.31 (s, 2H), 4.25 (q, J = 2.1 Hz, 2H), 4.09 (dd, J = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 3.85 (dt, J = 3.0, 12.3 Hz, 2H), 3.68-3.56 (m, 2H),
15 2.61 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 1.83-1.43 (m, 8H), 1.75 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.38-1.12 (m, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 24 (101)

1-ブチル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-

(4-ヒドロキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

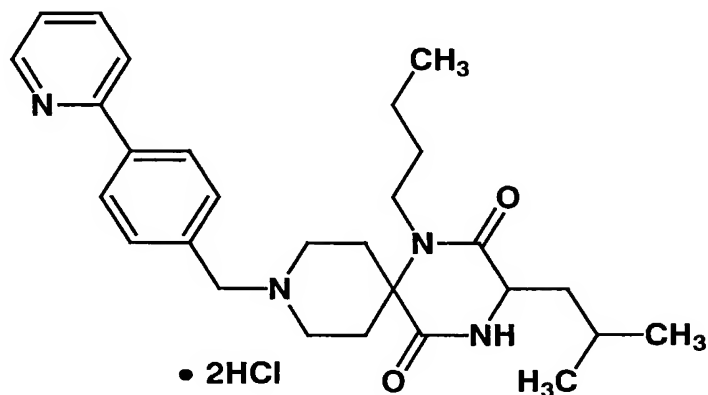


TLC: R_f 0.46 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.97 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.88 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.80 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.70 (m, 2H), 3.52-3.34 (m, 4H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.88-1.44 (m, 5H), 1.44-1.28 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

10 実施例 24 (102)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-2-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

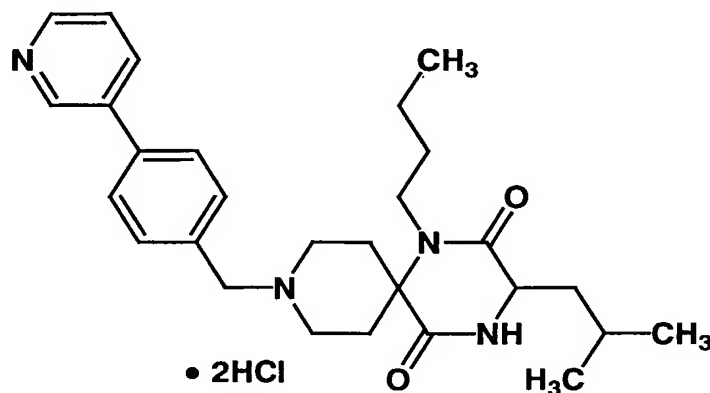


TLC : Rf 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.89 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.70 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.10-8.06 (m, 3H), 7.98 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.51 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.78 (m, 2H), 3.56-3.45 (m, 4H), 2.72-2.58 (m, 2H),
 5 2.24-2.08 (m, 2H), 1.84-1.44 (m, 5H), 1.44-1.34 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 24 (103)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-3-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.
 10 5]ウンデカン・2塩酸塩

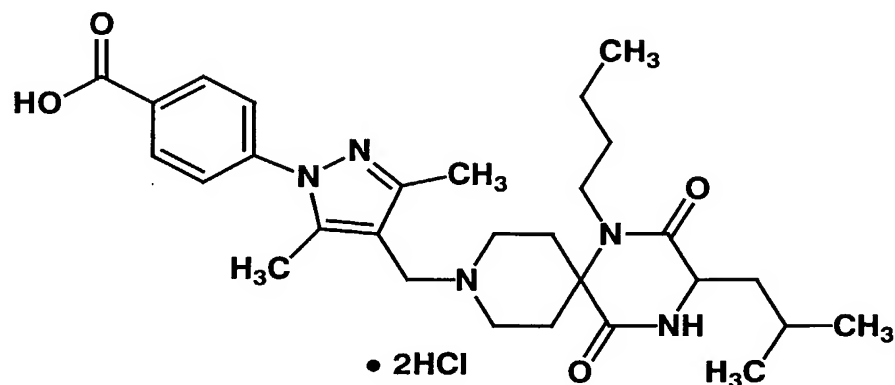


TLC : Rf 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 9.24 (s, 1H), 8.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.21 (dd, J = 8.4, 5.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.87 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.47 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.75 (m, 2H), 3.58-3.44 (m, 4H), 2.64-2.50 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.88-1.48 (m, 5H), 1.48-1.32 (m, 2H),
 15 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 24 (104)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

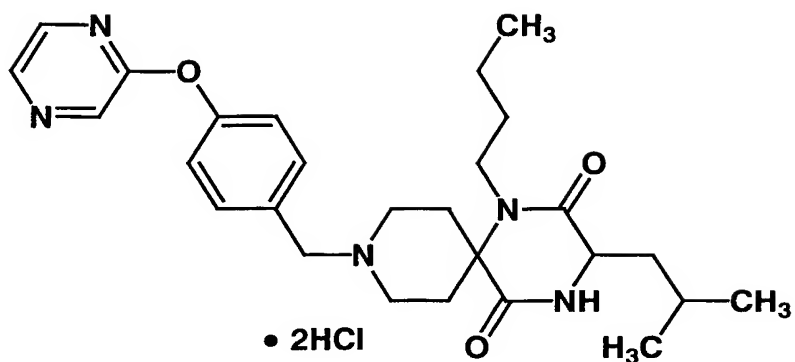


- 5 TLC : R_f 0.27 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.19 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.61 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.74 (m, 2H), 3.66-3.55 (m, 2H), 3.48-3.36 (m, 2H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.32-2.14 (m, 2H), 1.90-1.46 (m, 5H), 1.46-1.30 (m, 2H), 0.99-0.95 (m, 9H)。

10

実施例 24 (105)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピラジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

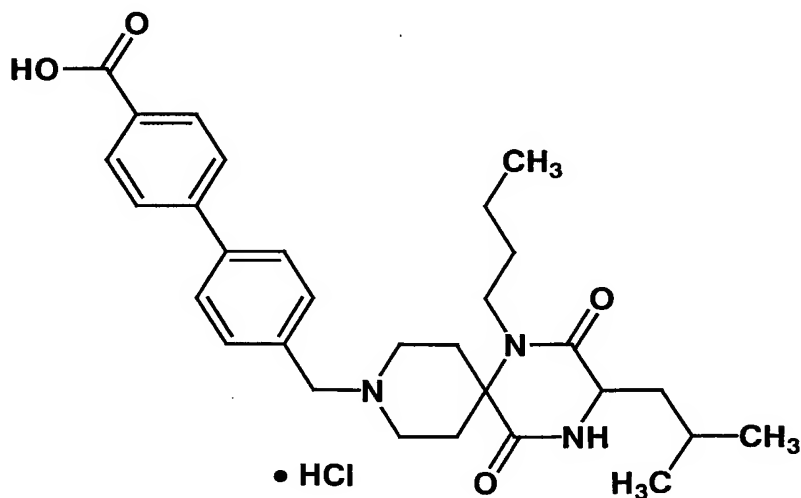


TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.47 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.13 (dd, J = 2.7, 1.5 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.73 (m, 2H), 3.58-3.46 (m, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H), 2.52-2.34 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.90-1.43 (m, 5H), 1.43-1.26 (m, 2H), 0.99-0.90 (m, 9H)。

実施例 24 (106)

- 10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-カルボキシフェニル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

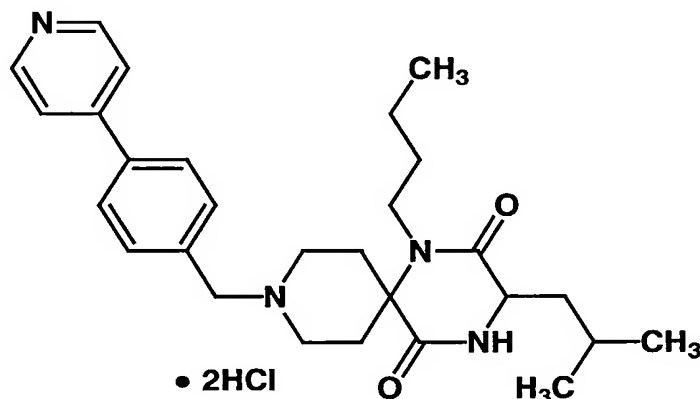


TLC : Rf 0.20 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.11 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.83 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.77 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.69 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.74 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.55-2.38 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H),
 5 1.88-1.44 (m, 5H), 1.44-1.30 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 24 (107)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-4-イル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
 10 5]ウンデカン・2塩酸塩



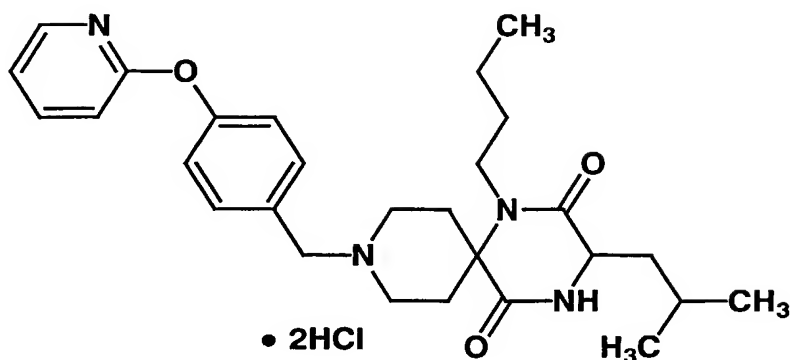
TLC : Rf 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.91 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 8.45 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 8.11 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.91 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H),
 15 3.96-3.78 (m, 2H), 3.58-3.40 (m, 4H), 2.64-2.48 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.96 - 0.93 (m, 9H)。

実施例 24 (108)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-

(ピリジン-2-イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

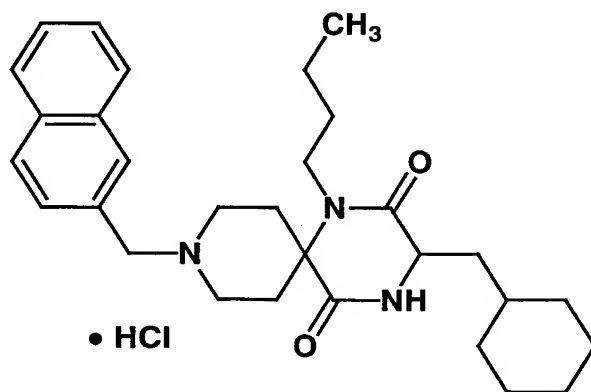


TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 8.44-8.15 (m, 2H), 7.82 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 7.60-7.40 (m, 1H), 7.42 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 7.27-7.24 (m, 1H), 4.43 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.70 (m, 2H), 3.58-3.40 (m, 4H), 2.64-2.42 (m, 2H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.92-1.28 (m, 7H), 0.97 - 0.94 (m, 9H)。

10 実施例 24 (109)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(ナフタレン-2-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



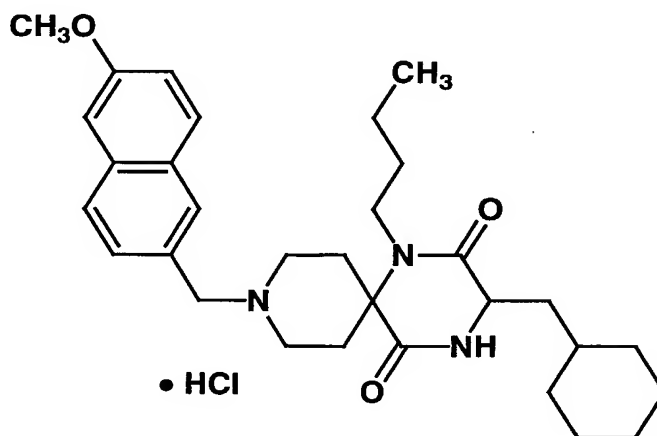
TLC : R_f 0.71 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.08-7.93 (m, 4H), 7.64-7.57 (m, 3H), 4.54 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.80 (m, 2H), 3.60-3.44 (m, 2H), 3.42-3.36 (m, 2H), 2.42-2.08 (m, 4H), 1.82-1.16 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

5

実施例 24 (110)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(6-メトキシナフタレン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

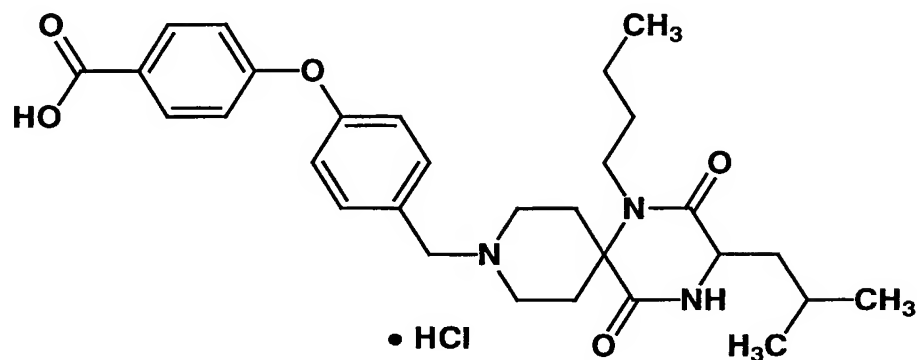
TLC : R_f 0.75 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.98 (s, 1H), 7.91 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.48 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.94-3.78 (m, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.58-3.44 (m, 2H), 3.42-3.36 (m, 2H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

15

実施例 24 (111)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-カルボキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

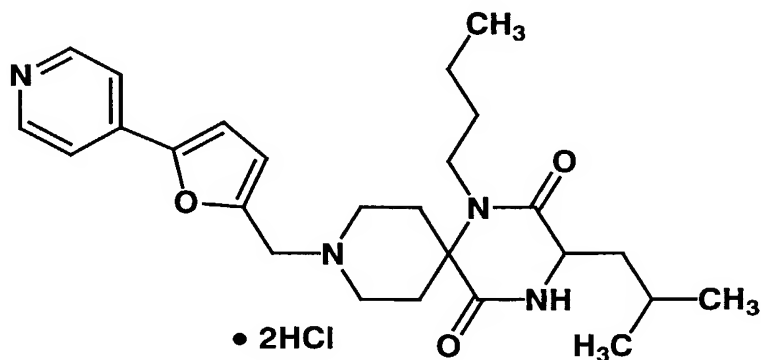


5. TLC : R_f 0.27 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.03 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.63 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.56-2.38 (m, 2H), 2.25-2.10 (m, 2H), 1.84-1.44 (m, 5H), 1.44-1.39 (m, 2H), 0.98-0.93 (m, 9H)。

10

実施例 24 (112)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ピリジン-4-イル)フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



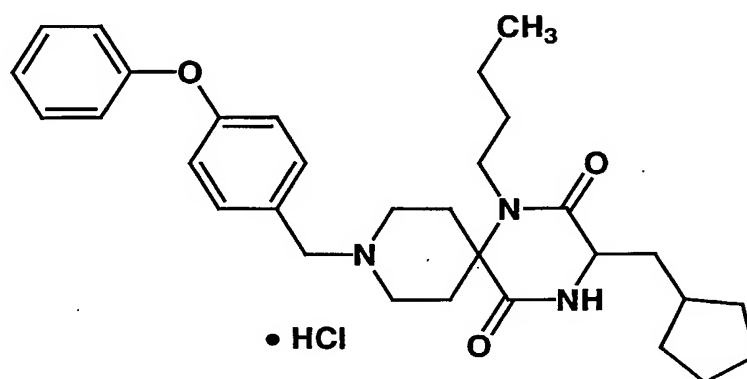
15

TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.80 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 8.39 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 7.69 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.62 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5, Hz, 1H), 3.99-3.79 (m, 2H), 3.65-3.43 (m, 4H), 2.72-2.54 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.88-1.26 (m, 7H), 1.00-0.84 (m, 9H)。

実施例 24 (113)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロペンチルメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



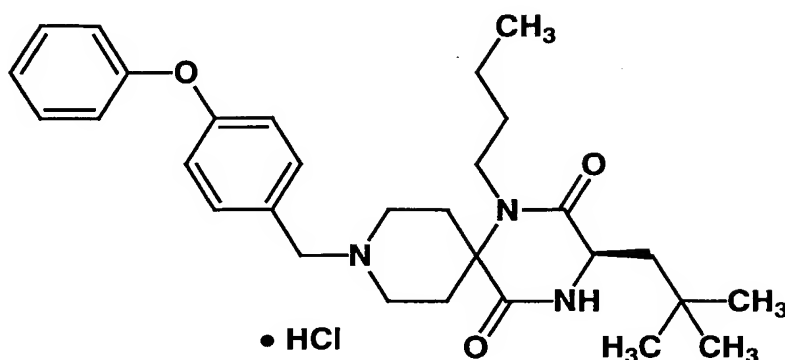
TLC : R_f 0.66 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.05 (m, 4H), 4.34 (s, 2H), 4.00 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 3.82 (m, 2H), 3.49 (m, 2H), 3.39 (m, 2H), 2.37 (m, 2H), 2.17 (m, 2H), 1.96 (m, 1H), 1.81 (m, 4H), 1.58 (m, 6H), 1.38 (m, 2H), 1.17 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 24 (114)

(3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピ

ル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザ
スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



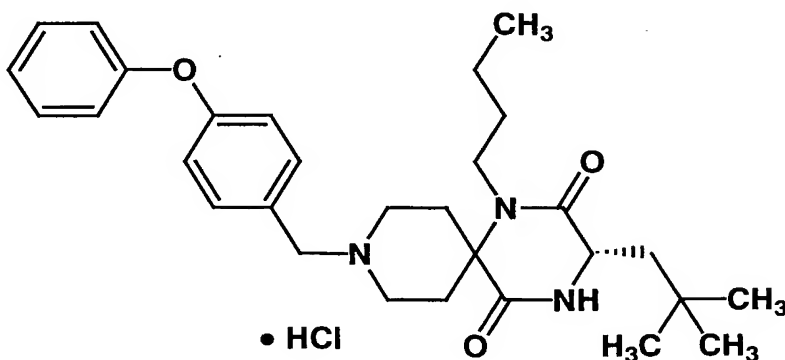
TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.04 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.2, 3.3 Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.71 (m, 1H), 3.50 (m, 2H), 3.43 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 2.24 (m, 2H), 2.00 (dd, J = 14.0, 3.3 Hz, 1H), 1.55 (dd, J = 14.0, 7.2 Hz, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.36 (m, 2H), 0.99 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

10

実施例 24 (115)

(3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザ
スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



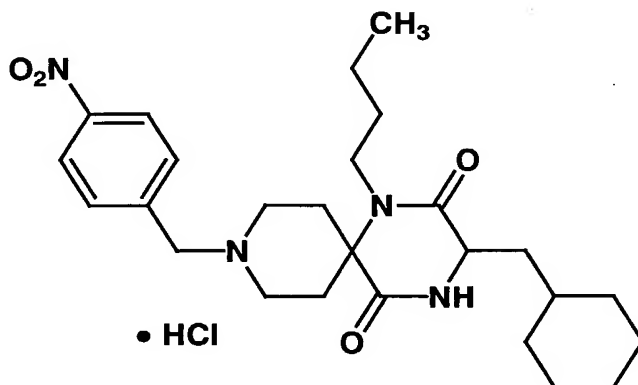
15

TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.04 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.2, 3.3 Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.71 (m, 1H), 3.50 (m, 2H), 3.43 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 2.24 (m, 2H), 2.00 (dd, J = 14.0, 3.3 Hz, 1H), 1.55 (dd, J = 14.0, 7.2 Hz, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.36 (m, 2H), 0.99 (s, 9H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 24 (116)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-ニトロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

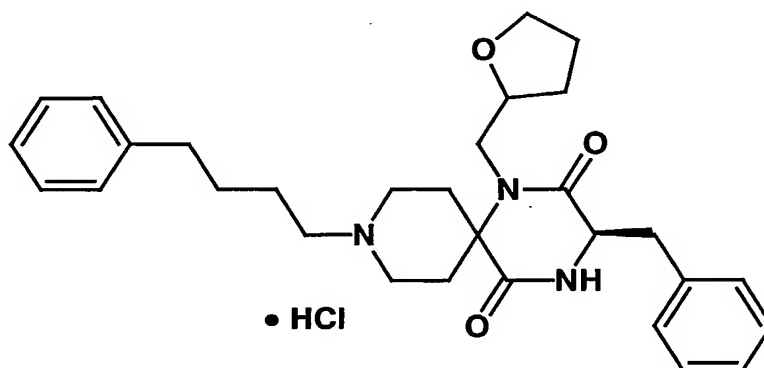


TLC : R_f 0.68 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.33 (d, J=8.7Hz, 2H), 7.78 (d, J=8.7Hz, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.03 (dd, J=7.5, 4.5Hz, 1H), 3.93-3.76 (m, 2H), 3.55-3.43 (m, 2H), 3.40-3.31 (m, 2H), 2.45-2.28 (m, 2H), 2.27-2.08 (m, 2H), 1.83-1.14 (m, 15H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

実施例 24 (117)

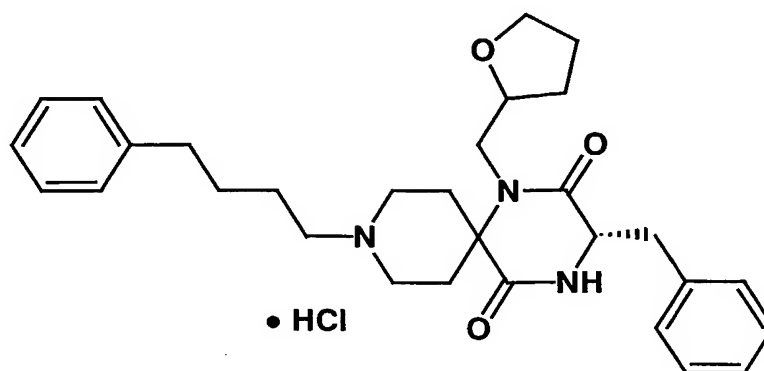
(3R)-1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



- 5 TLC : Rf 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CDCl₃) : δ 7.38-7.14 (m, 10H), 6.00 - 5.75 (m, 1H), 4.40-4.15 (m, 2H),
3.92-3.58 (m, 3H), 3.58-2.25 (m, 13H), 2.18-1.45 (m, 10H)。

实施例 24 (1 1 8)

- 10 (3S) - 1 - (テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキ
ソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

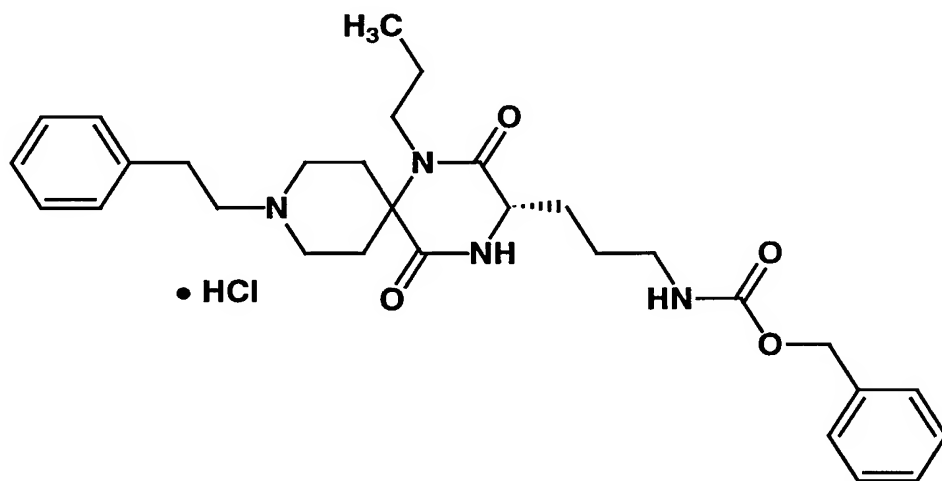


TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CDCl₃) : δ 7.40-7.15 (m, 10 H), 6.05 - 5.80 (m, 1H), 4.40-4.10 (m, 2 H), 3.90-3.55 (m, 3 H), 3.55-2.20 (m, 13 H), 2.18-1.45 (m, 10 H)。

5 実施例 24 (119)

(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



10 TLC : R_f 0.32 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

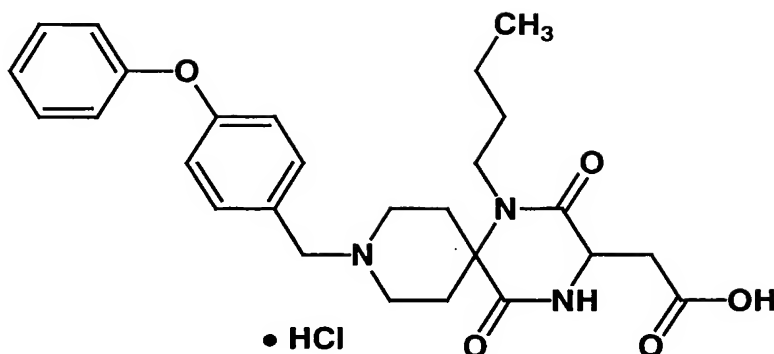
NMR (CD₃OD) : δ 7.40 - 7.20 (m, 10 H), 5.06 (s, 2 H), 4.09 (dd, J = 5.2, 4.6 Hz, 1 H), 4.00 - 3.70 (m, 2 H), 3.70 - 3.55 (m, 2 H), 3.50 - 3.30 (m, 4 H), 3.20 - 3.00 (m, 4 H), 2.65 - 2.35 (m, 2 H), 2.30 - 2.10 (m, 2 H), 2.00 - 1.75 (m, 2 H), 1.70 - 1.40 (m, 4 H), 0.96 (t, J = 7.4 Hz, 3 H)。

15

実施例 25

1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (カルボキシメチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ

ンデカン・塩酸塩



実施例 24 (11) で製造した化合物 (173 mg) のメタノール (5 mL) 溶液に、2 N 水酸化ナトリウム水溶液 (2 mL) を加えた。反応混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に 2 N 塩酸水溶液を pH が 4 になるまで加え、酢酸エチルで抽出した。抽出物を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮した。得られた残渣を 1, 4-ジオキサンに溶解し、4 N 塩酸・1, 4-ジオキサン溶液を加えた。反応混合物を濃縮し、得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄し、乾燥し、以下の物性値を有する本発明化合物 (127 mg) を得た。

TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 4 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : 7.55-7.53 (m, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.20-7.15 (m, 1H),
 7.07-7.02 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.27 (t, J = 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.90 (m, 1H), 3.72-3.66 (m, 1H), 3.54-3.38 (m, 4H), 2.97 (dd, J = 18.0, 4.8 Hz, 1H), 2.79 (dd, J = 18.0, 4.8 Hz, 1H), 2.50-2.36 (m, 3H), 2.27-2.16 (m, 1H), 1.62-1.48 (m, 2H), 1.41-1.30 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

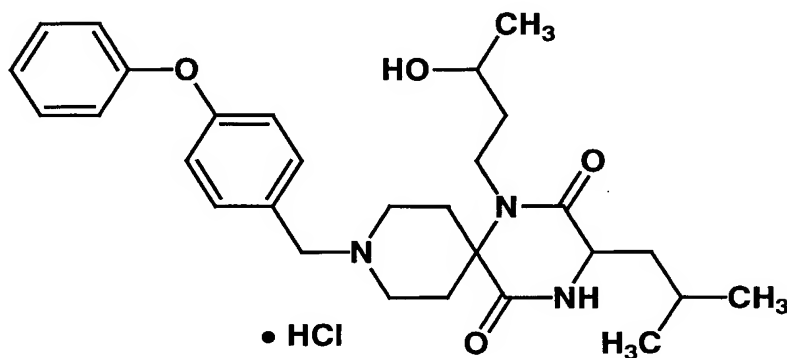
実施例 26 (1) ~ 26 (3)

参考例 2 で製造した樹脂 (3) および N-アリルオキシカルボニル-4-
 ピペリドンを用いて、n-プロピルアミンおよび N-(t-ブチルオキシカ

ルボニル) ロイシンの代わりにそれぞれ相当する化合物を用いて、参考例 3
 →参考例 4 と同様の操作をし、さらに 3, 5-ジメチル-1-フェニル-4-
 ホルミルピラゾールの代わりに、相当する化合物を用いて、参考例 5 →参
 考例 6 →実施例 1 と同様の操作をし、さらに、水酸基が一部アセチル化され
 5 たために、実施例 2 5 と同様の操作をし、以下の本発明化合物を得た。

実施例 2 6 (1)

1- (3-ヒドロキシブチル) - 2, 5-ジオキソ- 3- (2-メチルプロ
 ピル) - 9- (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリア
 10 ザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

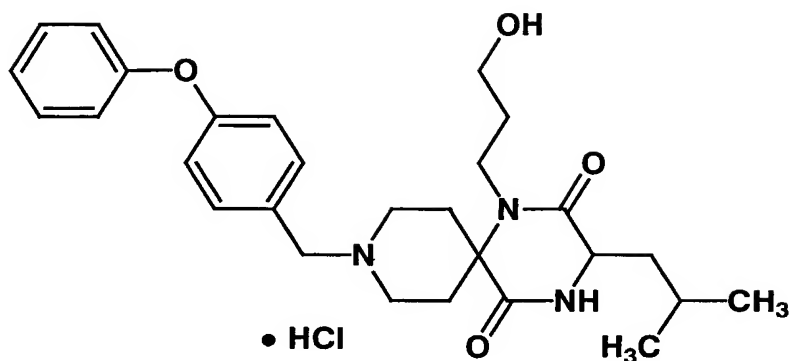


TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.39 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J
 = 7.5 Hz, 1H), 7.04 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.02 (m, 1H), 3.80 (m, 3H), 3.51 (m,
 15 4H), 2.46 (m, 2H), 2.19 (m, 2H), 1.85-1.57 (m, 5H), 1.17 (d, J = 6.0 Hz, 3H),
 0.94 (d, J = 9.0 Hz, 6H)。

実施例 2 6 (2)

1- (3-ヒドロキシプロピル) - 2, 5-ジオキソ- 3- (2-メチルプロ
 20 ピル) - 9- (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリ

アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

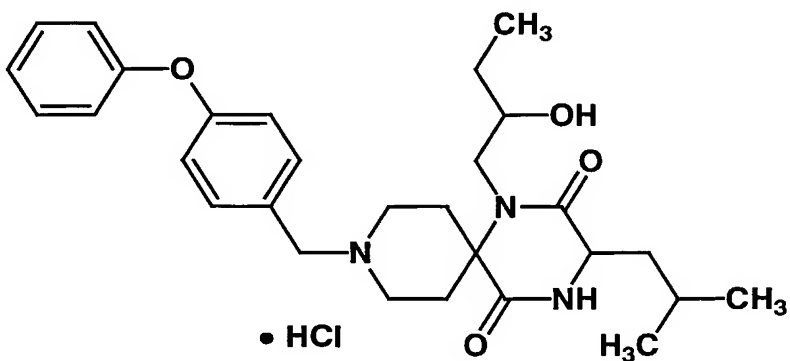


TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.04 (m, 4H), 4.34 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.0 Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 3.60 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 3.48 (m, 4H), 2.40 (m, 2H), 2.20 (m, 2H), 1.82-1.58 (m, 5H), 0.94 (d, J = 6.0 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.0 Hz, 3H)。

実施例 26 (3)

- 10 1 - (2-ヒドロキシブチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



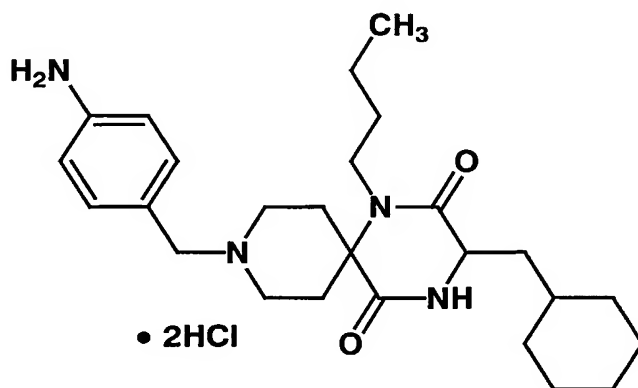
TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 8.1, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.41 (m, 6H), 3.27-3.14 (m, 1H), 2.68-2.53 (m, 1H), 2.37-2.26 (m, 3H), 1.94-1.24 (m, 5H), 1.08-0.82 (m, 9H)。

5

実施例 27

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-アミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



10

実施例 24 (116) で製造した化合物 (50 mg) のメタノール溶液にアルゴン雰囲気下、5%パラジウム-炭素 (10 mg) を加えた。反応混合物を水素ガス雰囲気下、室温で20分間攪拌した。反応混合物をセライト (商品名) を通して、ろ過し、ろ液を濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム: メタノール = 50 : 1 → 30 : 1 → 20 : 1) によって精製した。得られた化合物をメタノールに溶解し、4N塩酸/酢酸エチル溶液を加え、濃縮した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄し、乾燥し、以下の物性値を有する本発明化合物 (34 mg) を得た。

15

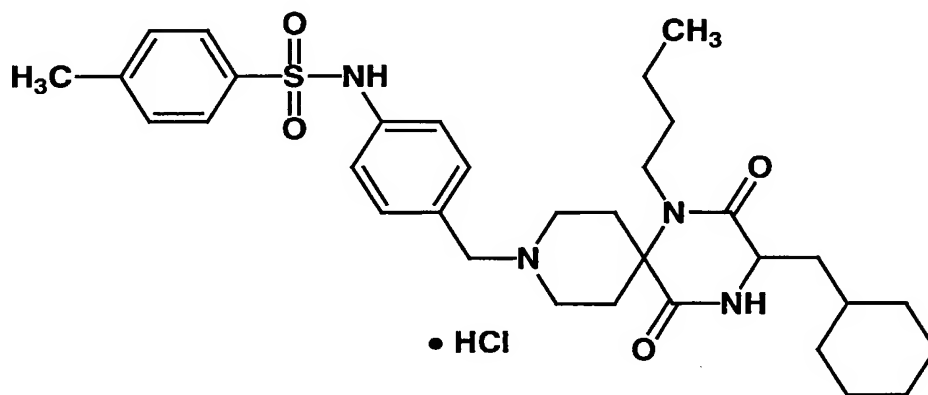
TLC : R_f 0.21 (クロロホルム: メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.80 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.47 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.74 (m, 2H), 3.52-3.45 (m, 4H), 2.65-2.52 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.80-1.16 (m, 15H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.94 (m, 2H)。

5

実施例 28

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-((4-メチルフェニル)スルホニルアミノ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

実施例 28 で製造した化合物 (33 mg) のピリジン (2 ml) 溶液に、
 p-トルエンスルホニルクロライド (21 mg) を加えた。反応混合物を室
 温で 27 時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶
 液を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出物を飽和塩化ナトリウム水溶液で洗
 15 浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムク
 ロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール=10：1) によって精製し
 た。得られた化合物をメタノールに溶解し、4 N 塩酸／酢酸エチル溶液を加
 え、濃縮した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄し、乾燥し、以下の
 物性値を有する本発明化合物 (27 mg) を得た。

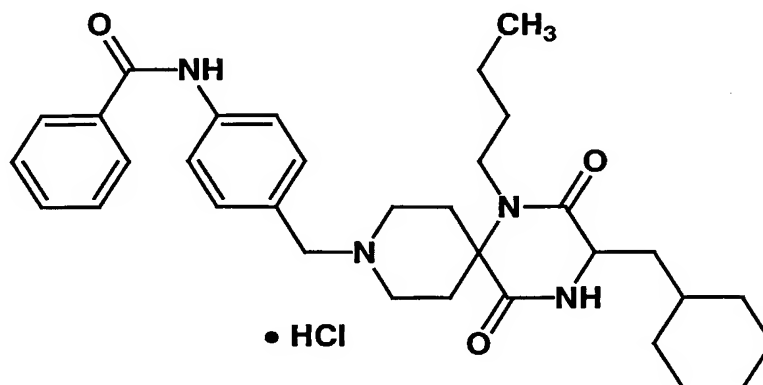
TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.70 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.41 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.22 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.25 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.2, 4.5 Hz, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.42 (m, 4H), 2.42-2.06 (m, 4H), 2.37 (s, 3H), 1.82-1.10 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 28 (1)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(フェニルカルボニルアミノ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ

10 [5.5] ウンデカン・2 塩酸塩



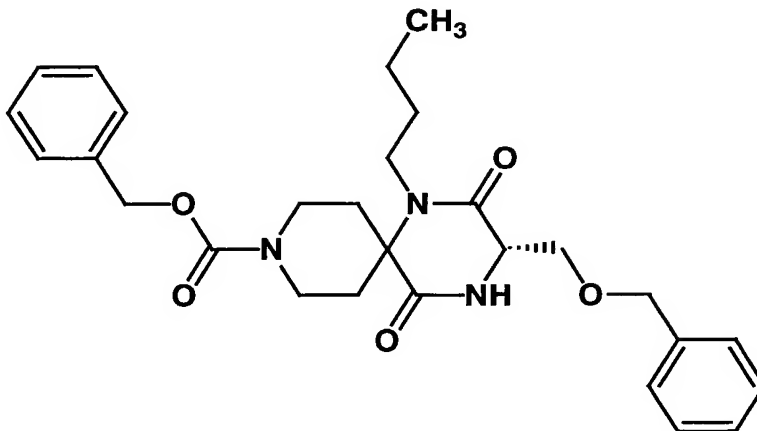
p-トルエンスルホニルクロライドの代わりに、ベンゾイルクロライドを用いて、実施例 28 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

15 TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.93 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.88 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.61-7.50 (m, 5H), 4.34 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 3.42 (m, 4H), 2.24 (m, 4H), 1.82-1.16 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 29

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - ベンジルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



5

参考例 2 で製造した樹脂 (3) および N - ベンジルオキシカルボニル - 4 - ピペリドン、O - ベンジル - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - L - セリンを用いて、参考例 3 → 参考例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

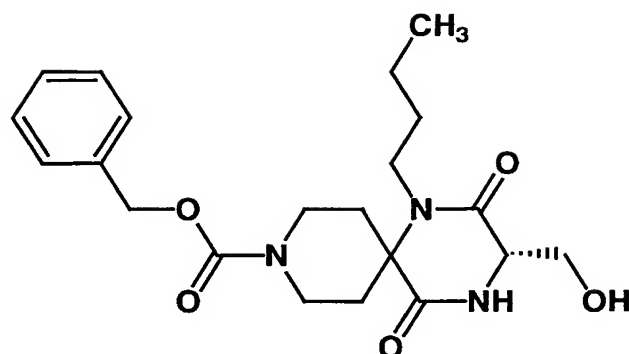
- 10 TLC : R_f 0.66 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CDCl₃) : δ 7.40-7.25 (m, 10H), 6.09 (brs, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.54 (s, 2H), 4.20-3.98 (br, 2H), 4.18 (dd, J = 8.4, 3.6 Hz, 1H), 3.93 (dd, J = 9.3, 3.6 Hz, 1H), 3.80-3.56 (br, 1H), 3.66 (dd, J = 9.3, 8.4, Hz, 1H), 3.45-3.12 (m, 3H), 2.02-1.75 (m, 4H), 1.57-1.39 (m, 2H), 1.38-1.20 (m, 2H), 0.91 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

15

実施例 30

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ヒドロキシメチル - 9 - ベンジルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカ

ン



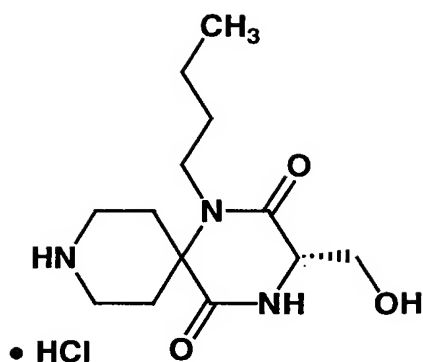
実施例 29 で製造した化合物 (245 mg) のジクロロメタン (5 ml) 溶液に、 -40°C で三臭化ホウ素の 1 M ジクロロメタン溶液 (1.4 ml) を加え、 -20°C で 3 時間攪拌した。反応混合物に水と飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出物を水、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 30 : 1) によって精製し、以下の物性値を有する本発明化合物 (173 mg) を得た。

- 10 TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CDCl₃) : δ 7.42-7.27 (m, 5H), 6.26-6.15 (br, 1H), 5.16 (s, 2H), 4.26-4.00 (m, 2H), 3.98-3.82 (m, 2H), 3.84-3.60 (br, 1H), 3.43-3.13 (m, 4H), 2.80-2.68 (br, 1H), 2.05-1.75 (m, 4H), 1.58-1.40 (m, 2H), 1.40-1.20 (m, 2H), 0.92 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

15

実施例 31

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ヒドロキシメチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



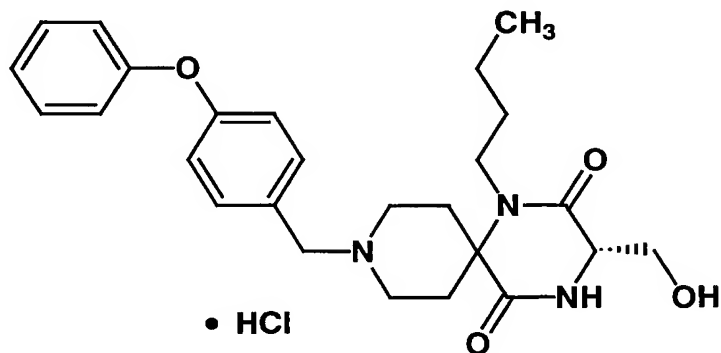
実施例 30 で製造した化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.21 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 4 : 1) ;

- 5 NMR (d₆-DMSO) : δ 7.83 (brs, 1H), 5.10-4.90 (br, 1H), 3.88-3.78 (m, 1H), 3.76-3.65 (m, 1H), 3.58-3.48 (m, 1H), 3.28-3.18 (m, 1H), 3.18-3.04 (m, 3H), 2.88-2.75 (m, 2H), 1.94-1.83 (m, 1H), 1.83-1.64 (m, 3H), 1.56-1.42 (m, 1H), 1.42-1.20 (m, 3H), 0.88 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

10 実施例 32 (1)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



- 15 4-フェニルオキシベンズアルデヒドと実施例 31 で製造した化合物を用

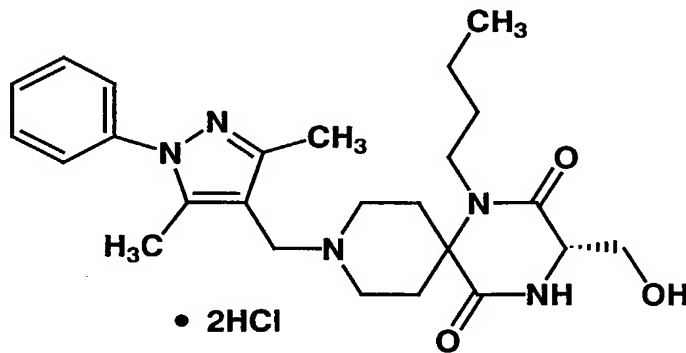
いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.22-7.14 (m, 1H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.06-7.00 (m, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.03-3.90 (m, 3H), 3.79-3.66 (m, 1H), 3.65 (dd, J = 10.5, 2.4 Hz, 1H), 3.61-3.42 (m, 3H), 3.30-3.18 (m, 1H), 2.50-2.24 (m, 3H), 2.24-2.12 (m, 1H), 1.76-1.58 (m, 1H), 1.54-1.26 (m, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

10 実施例 32 (2)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



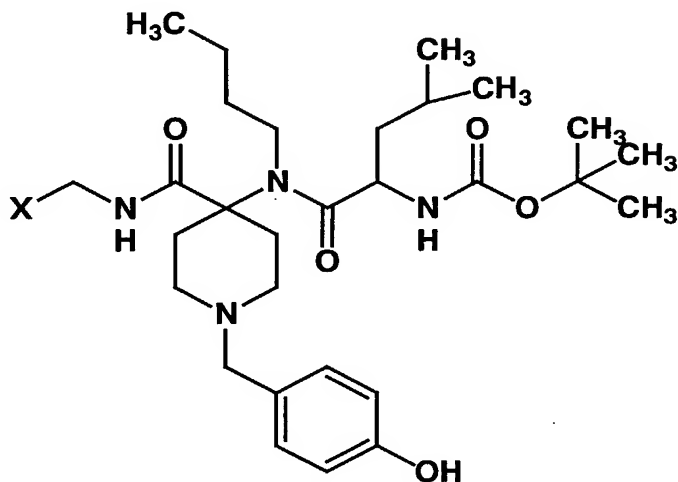
15 1-フェニル-3,5-ジメチル-4-ホルミルピラゾールと実施例 31 で製造した化合物を用いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.46 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.08-3.92 (m, 3H), 3.83-
20 3.70 (m, 1H), 3.66 (dd, J = 10.5, 2.4 Hz, 1H), 3.66-3.52 (m, 3H), 3.40-3.25 (m,

1H), 2.64-2.50 (m, 1H), 2.50-2.40 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.28-2.15 (m, 1H), 1.80-1.58 (m, 1H), 1.58-1.30 (m, 3H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

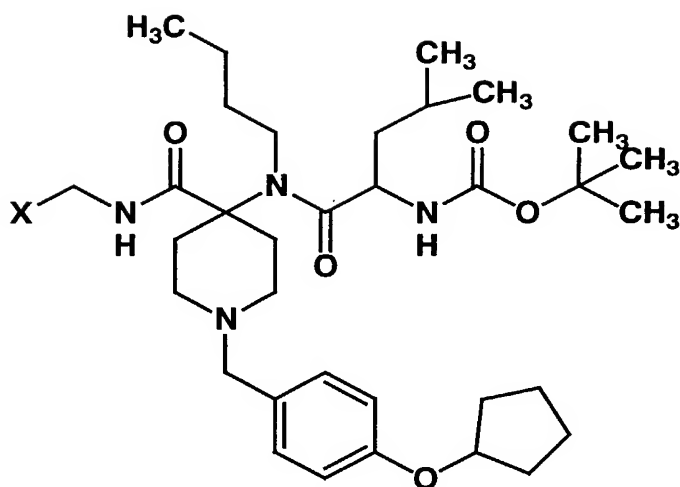
参考例 11 : 化合物 (7) の合成



5

参考例 2 で製造した樹脂 (3) および N-アリルオキシカルボニル-4-
 ピペリドン、n-ブチルアミンおよび N-(t-ブチルオキシカルボニル)
 ロイシンを用いて、参考例 3→参考例 4 と同様の操作をし、さらに 3, 5-
 ジメチル-1-フェニル-4-ホルミルピラゾールの代わりに、4-ヒドロ
 10 キシベンズアルデヒドを用いて、参考例 5 と同様の操作をし、化合物 (7)
 を得た。

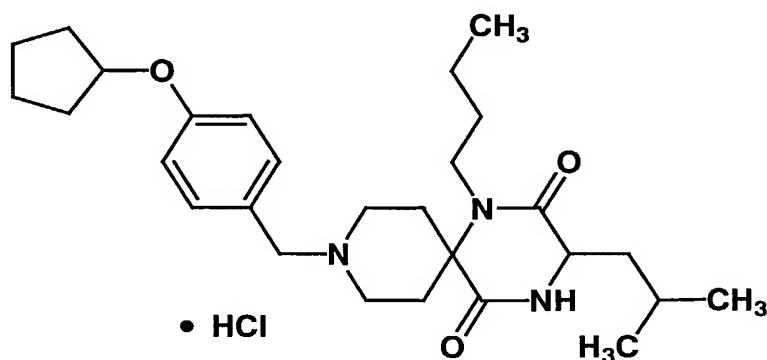
参考例 12 : 化合物 (8) の合成



- 参考例 11 で製造した化合物 (60 mg) のジクロロメタン (2 ml) 懸濁液に、トリフェニルホスフィン (80 mg) と 1 M のシクロペンタノールのジクロロメタン溶液 (0.302 ml) とジエチルアゾジカルボキシレート (0.137 ml) を加えた。反応混合物を室温で 18 時間攪拌した。反応液をろ過し、得られた樹脂をジクロロメタン (2 ml × 4 回)、メタノール (2 ml × 3 回)、ジクロロメタン (3 ml × 4 回) で洗浄し、化合物 (8) を得た。

実施例 33

- 10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩



参考例 1 2 で製造した化合物を用いて、参考例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

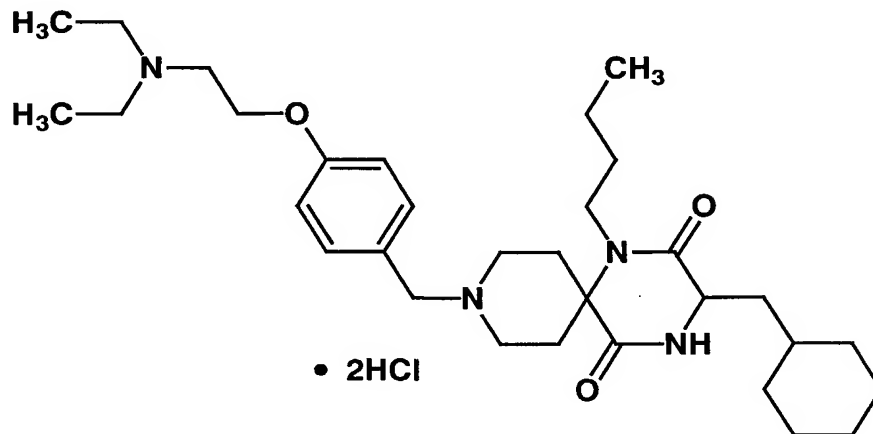
NMR (CD₃OD) : δ 7.41 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.98 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.83 (m, 1H), 4.25 (brs, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.65 (m, 2H), 3.53-3.27 (m, 4H), 2.40-2.06 (m, 4H), 2.02-1.43 (m, 13H), 1.43- 1.24 (m, 2H), 1.01-0.90 (m, 9H)。

実施例 33 (1) ~ 33 (6)

- 10 n-ブチルアミンおよびN-(t-ブチルオキシカルボニル)ロイシンの代わりに、相当する化合物を用いて、参考例 1 1 と同様の操作をし、シクロペンタノールの代わりに、相当する化合物を用いて、参考例 1 2 → 実施例 3 3 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

15 実施例 33 (1)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(2-ジエチルアミノエチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2塩酸塩

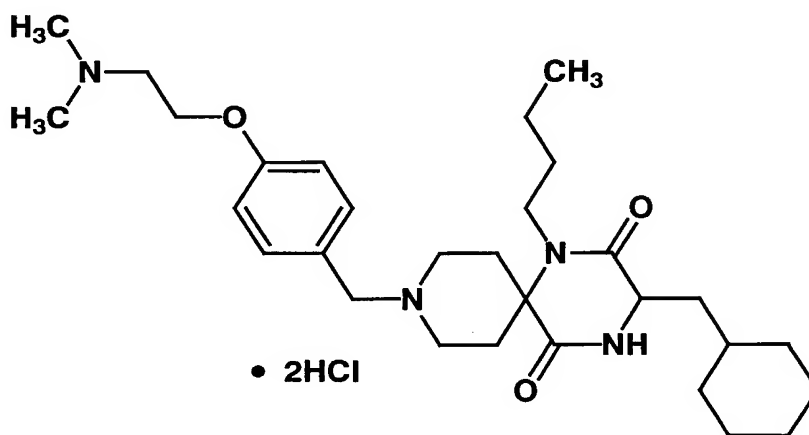


TLC: Rf 0.54 (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=80:10:1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.40 (t, J = 4.8 Hz, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 5.1 Hz, 1H), 3.84-3.67 (m, 2H), 3.63 (t, J = 4.8 Hz, 2H), 3.50-3.40 (m, 4H), 3.40-3.31 (m, 4H), 2.58-2.41 (m, 2H), 2.23-2.04 (m, 2H), 1.82-1.42 (m, 10H), 1.41-1.12 (m, 11H), 1.04-0.87 (m, 5H)。

実施例 33 (2)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(2-ジメチルアミノエチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

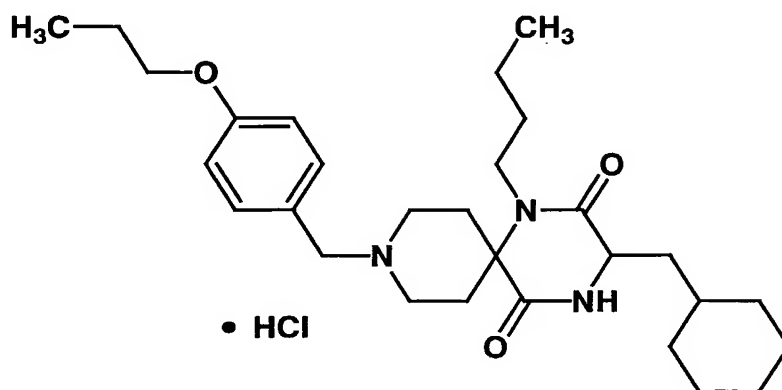


TLC: Rf 0.46 (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=80:10:1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.39 (t, J = 4.8 Hz, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.67 (m, 2H), 3.61 (t, J = 4.8 Hz, 2H), 3.50-3.38 (m, 4H), 2.98 (s, 6H), 2.59-2.42 (m, 2H), 2.24-2.03 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

実施例 3 3 (3)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-プロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

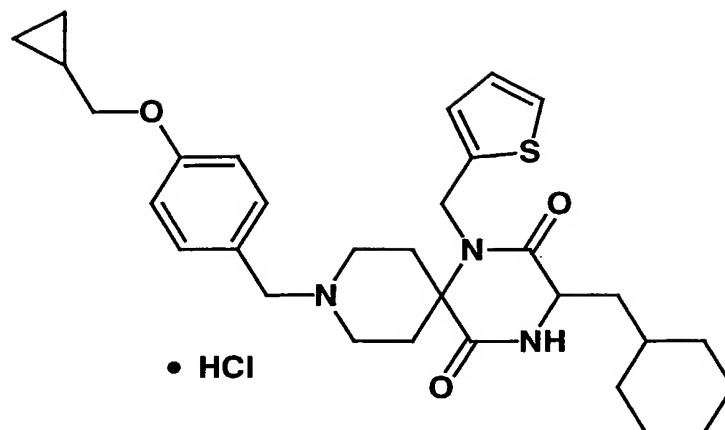


TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.43 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.27 (brs, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.85-3.67 (m, 2H),
 10 3.53-3.33 (m, 4H), 2.45-2.27 (m, 2H), 2.26-2.07 (m, 2H), 1.86-1.14 (m, 17H),
 1.03 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.00-0.89 (m, 5H)。

実施例 3 3 (4)

1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

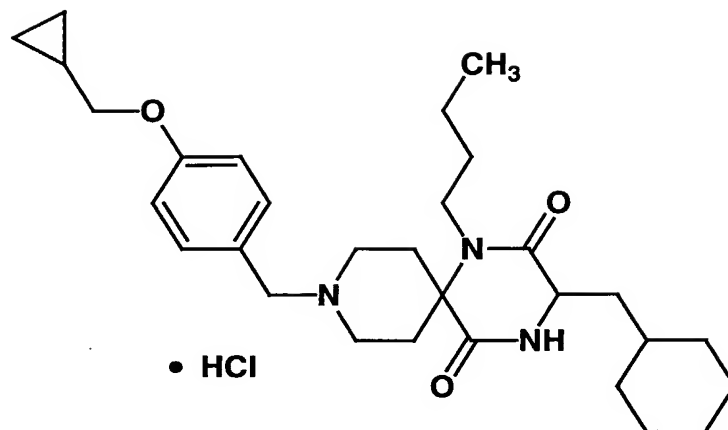


TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.42 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.27 (dd, J = 5.4, 0.9 Hz, 1H),
 7.06-6.97 (m, 3H), 6.91 (dd, J = 5.4, 3.6 Hz, 1H), 4.95-4.85 (m, 2H), 4.27 (brs,
 5 2H), 4.14 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 3.84-3.66 (m, 2H),
 3.51-3.39 (m, 2H), 2.59-2.36 (m, 2H), 2.24-2.07 (m, 2H), 1.84-1.44 (m, 8H),
 1.35-1.12 (m, 4H), 1.04-0.85 (m, 2H), 0.66-0.57 (m, 2H), 0.38-0.31 (m, 2H)。

実施例 33 (5)

- 10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-シ
 クロプロピルメチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ
 [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

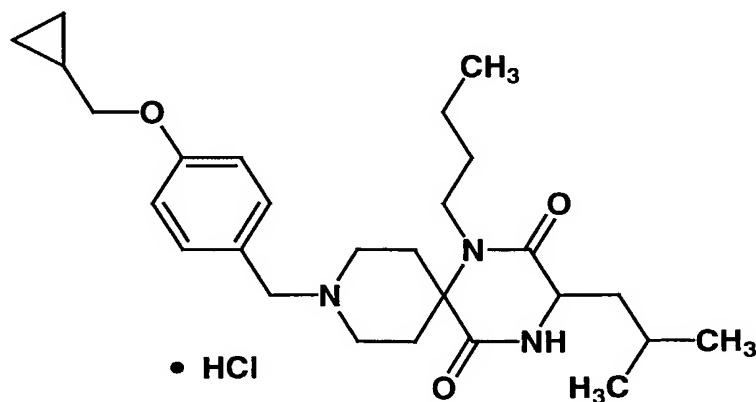


TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.42 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.26 (brs, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 3.83-3.66 (m, 2H),
 5 3.51-3.33 (m, 4H), 2.44-2.26 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 1.82-1.12 (m, 16H),
 1.04-0.86 (m, 5H), 0.66-0.57 (m, 2H), 0.38-0.31 (m, 2H)。

実施例 33 (6)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-
 10 シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピ
 ロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

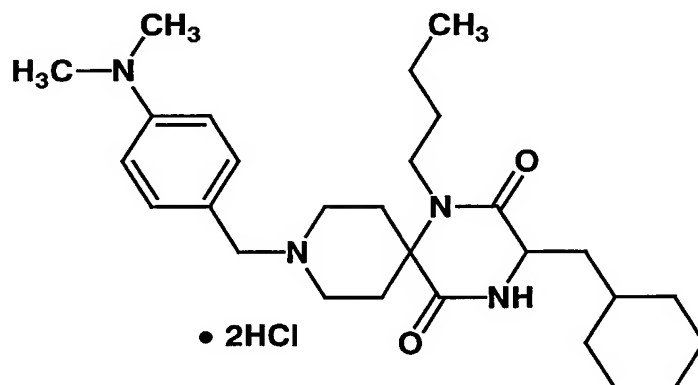


TLC : Rf 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.42 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.26 (brs, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 3.84-3.66 (m, 2H), 3.50-3.33 (m, 4H), 2.43-2.26 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.89-1.43 (m, 5H),
 5 1.43-1.17 (m, 3H), 1.00-0.88 (m, 9H), 0.66-0.58 (m, 2H), 0.38-0.31 (m, 2H)。

実施例 34

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(ジメチルアミノ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]
 10 ウンデカン・2塩酸塩



4-ジメチルアミノベンズアルデヒドと実施例 9 (1) で製造した化合物を用いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

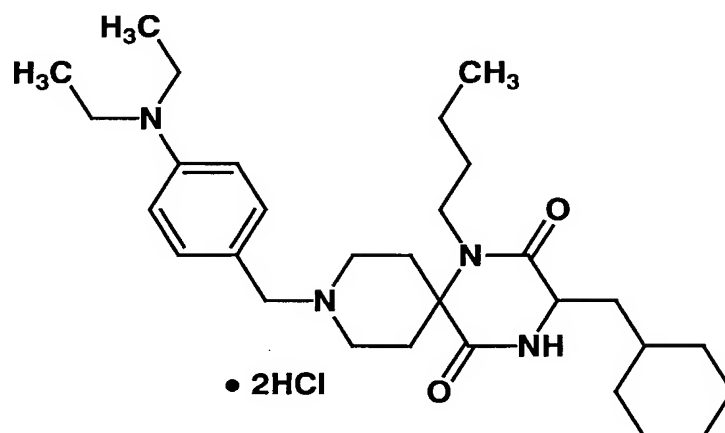
15 TLC : Rf 0.26 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.78 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.52-3.40 (m, 4H), 3.26 (s, 6H), 2.64-2.47 (m, 2H), 2.24-2.04 (m, 2H), 1.82-1.12 (m, 15H), 1.04-0.88 (m, 5H)。

実施例 3 4 (1)

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(ジエチルアミノ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]

5 ウンデカン・2 塩酸塩

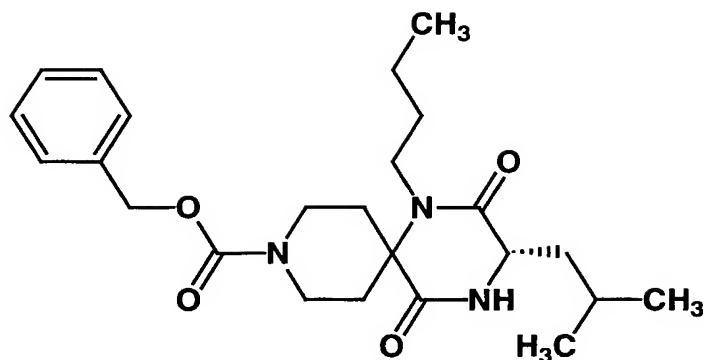


4-ジメチルアミノベンズアルデヒドの代わりに、4-ジエチルアミノベンズアルデヒドを用いて、実施例 3 4 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

- 10 TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.94-7.78 (m, 2H), 7.72-7.52 (m, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8, Hz, 1H), 3.92-3.73 (m, 2H), 3.73-3.60 (m, 4H), 3.54-3.40 (m, 4H), 2.63-2.45 (m, 2H), 2.25-2.05 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 21 H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

15 実施例 3 5

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジルオキシカルボニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



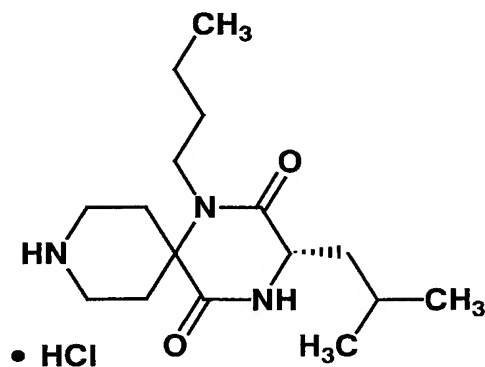
参考例 2 で製造した樹脂 (3)、N-ベンジルオキシカルボニル-4-ピ
ペリドン、n-ブチルアミン、N-(t-ブチルオキシカルボニル)-L-
ロイシンを用いて、参考例 3→参考例 6→実施例 1 と同様の操作をし、以下
5 の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.35 (m, 5H), 6.50 (brs, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.08 (m, 2H),
3.96 (m, 1H), 3.62 (brs, 1H), 3.44 (brs, 1H), 3.26 (m, 2H), 1.95-1.76 (m, 4H),
1.61-1.45 (m, 5H), 1.31 (m, 2H), 0.96 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.3 Hz,
10 3H), 0.91 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 3 6

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



実施例 3 5 で製造した化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

T L C : R f 0.18 (クロロホルム : メタノール = 4 : 1) ;

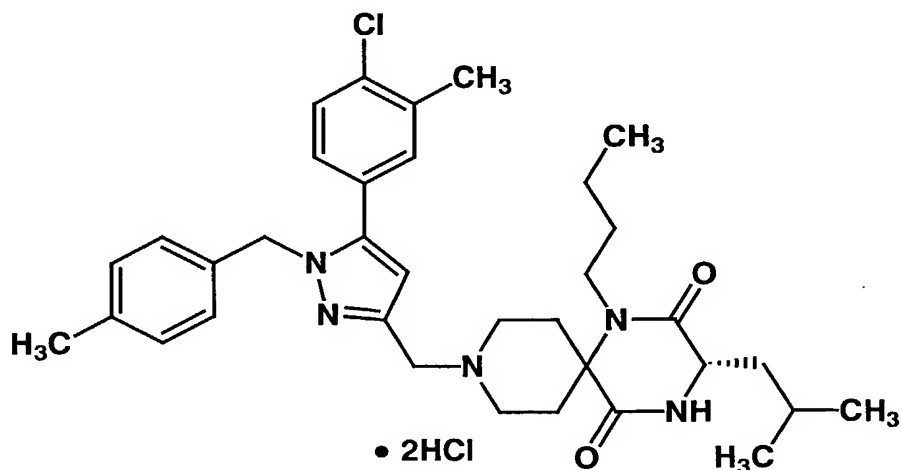
N M R (CD₃OD) : δ 4.02 (dd, J = 7.8, 4.6 Hz, 1H), 3.80 (dd, J = 12.5, 4.0 Hz, 1H),
 5 3.72 (dd, J = 12.5, 4.0 Hz, 1H), 3.39 (m, 4H), 2.34-2.09 (m, 4H), 1.88-1.50 (m, 5H), 1.37 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (1) ~ 3 7 (8 8)

10 実施例 3 6 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 3 7 (1)

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 15 9 - (5 - (3 - メチル - 4 - クロロフェニル) - 1 - (4 - メチルフェニルメチル) ピラゾール - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・2 塩酸塩

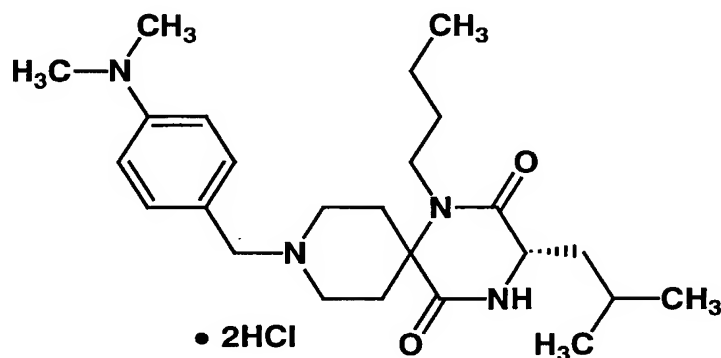


T L C : R f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 2 0 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.42 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.19 (dd, J = 8.1, 1.5 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 6.65 (s, 1H), 5.35 (s, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.97-3.76 (m, 2H), 3.64-3.52 (m, 2H), 3.46-3.35 (m, 2H), 2.56-2.38 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.91-1.46 (m, 5H), 1.46-1.30 (m, 2H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 6H)。

実施例 37 (2)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - ジメチルアミノフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩酸塩

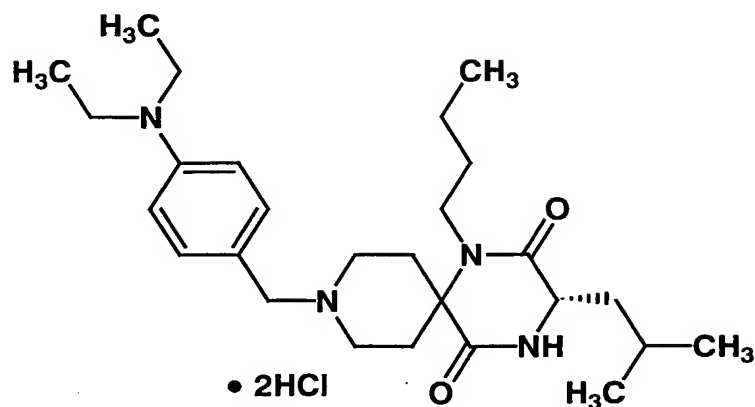


TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.78 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.58 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.82 (m, 2H), 3.42 (m, 4H), 3.26 (s, 6H), 2.56 (m, 2H), 2.18 (m, 2H), 1.88-1.30 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (3)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - ジエチルアミノフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ

[5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

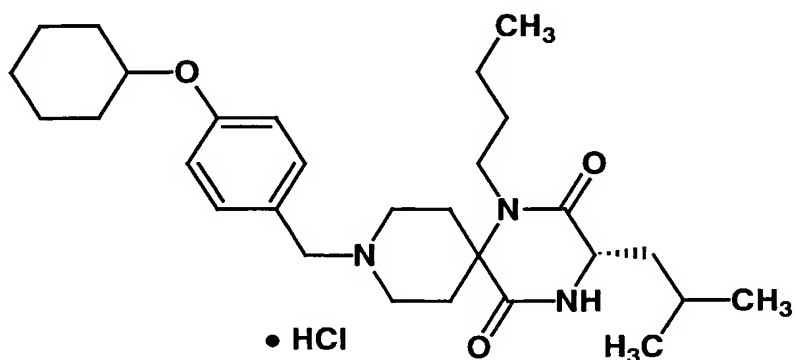


TLC : R f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.96-7.82 (m, 2H), 7.74-7.55 (m, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.60 (m, 6H), 3.55-3.40 (m, 4H), 2.65-2.48 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 1.89-1.26 (m, 7H), 1.15 (t, J = 7.2 Hz, 6H), 1.00-0.87 (m, 9H)。

実施例 37 (4)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - シクロヘキシルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



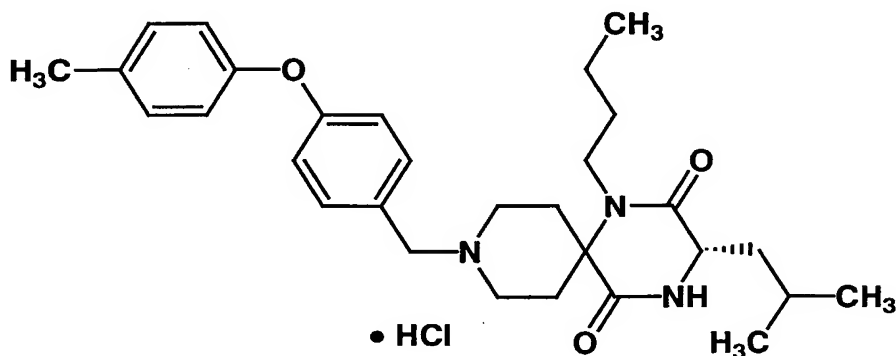
TLC : R f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.45-7.42 (m, 2H), 7.02-6.99 (m, 2H), 4.40-4.31 (m, 1H),

4.27 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 8.0, 4.5 Hz, 1H), 3.83-3.70 (m, 2H), 3.47 (brd, 2H),
3.42-3.35 (m, 2H), 2.43-2.32 (m, 2H), 2.24-2.11 (m, 2H), 2.00-1.93 (m, 2H),
1.86-1.32 (m, 15H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

5 実施例 37 (5)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (4 - (4 - メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 -
トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

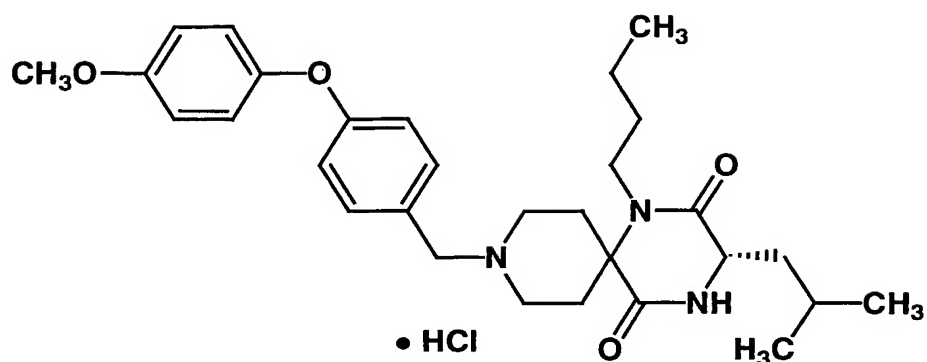


- 10 TLC : R_f 0.70 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 7.52-7.47 (m, 2H), 7.22-7.19 (m, 2H), 7.04-7.00 (m, 2H),
6.94-6.90 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 8.0, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.73 (m, 2H),
3.48 (brd, 2H), 3.42-3.34 (m, 2H), 2.45-2.33 (m, 5H), 2.25-2.12 (m, 2H), 1.85-
1.48 (m, 5H), 1.41-1.31 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

15

実施例 37 (6)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (4 - (4 - メトキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 -
トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

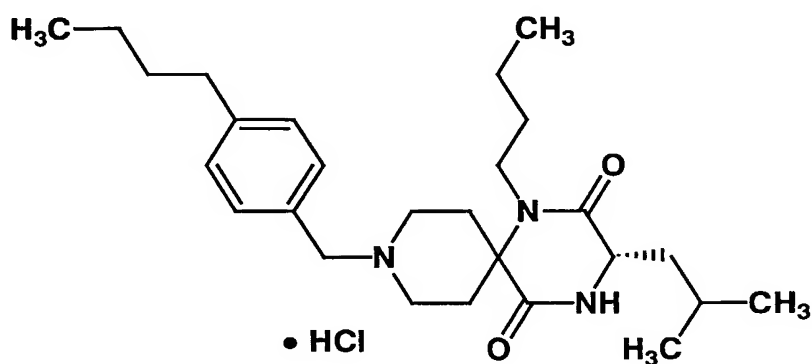


TLC : R_f 0.65 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.49-7.46 (m, 2H), 7.00-6.94 (m, 6H), 4.31 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 8.0, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.71 (m, 5H), 3.48 (brd, 2H), 3.40-3.31 (m, 2H), 2.42-2.30 (m, 2H), 2.25-2.12 (m, 2H), 1.83-1.48 (m, 5H), 1.41-1.30 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 37 (7)

(3S)-1-(4-(4-propylphenyl)phenyl)-2,5-dioxo-3-(2-methylpropyl)-9-(4-propylphenylmethyl)-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecan-11-yl hydrogen sulfate



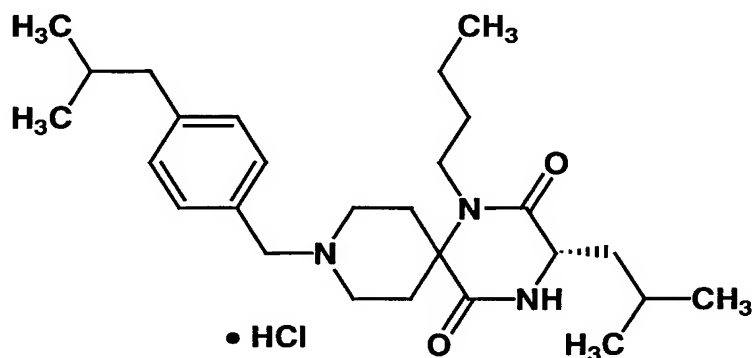
TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 4H), 2.67 (t,

$J = 7.8 \text{ Hz}$, 2H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 11H), 0.96 (t, $J = 7.2 \text{ Hz}$, 3H), 0.95 (d, $J = 6.3 \text{ Hz}$, 3H), 0.94 (d, $J = 6.3 \text{ Hz}$, 3H), 0.94 (t, $J = 7.2 \text{ Hz}$, 3H)。

5 実施例 37 (8)

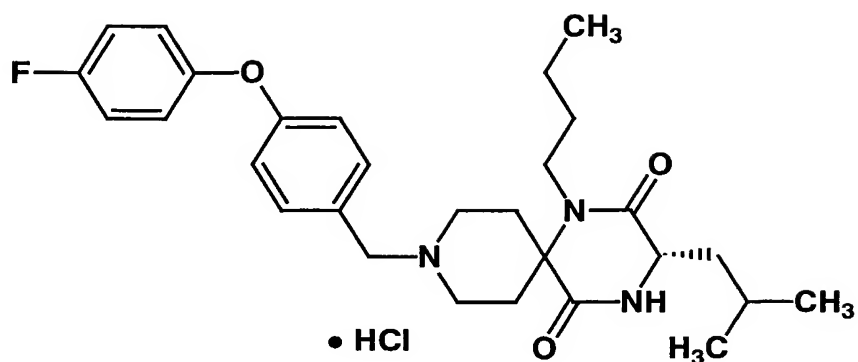
(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (2 - メチルプロピル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



- 10 TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, $J = 6.9 \text{ Hz}$, 2H), 7.30 (d, $J = 6.9 \text{ Hz}$, 2H), 4.33 (s, 2H),
 4.01 (dd, $J = 7.5, 4.5 \text{ Hz}$, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.56-3.34 (m, 4H), 2.53 (d, $J =$
 7.2 Hz, 2H), 2.53-2.30 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.96-1.26 (m, 8H), 0.95 (t, $J =$
 7.8 Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.6 \text{ Hz}$, 3H), 0.94 (d, $J = 6.6 \text{ Hz}$, 3H), 0.91 (d, $J = 6.6 \text{ Hz}$,
 15 6H)。

実施例 37 (9)

- (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - フルオロフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 -
 20 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

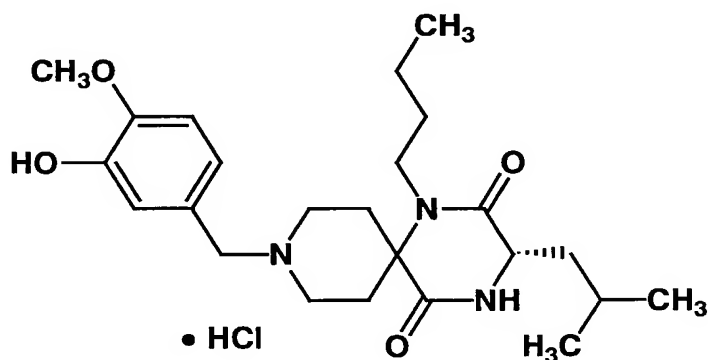


TLC : R_f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.16 - 7.04 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.46-2.10 (m, 4H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (10)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリ
アザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



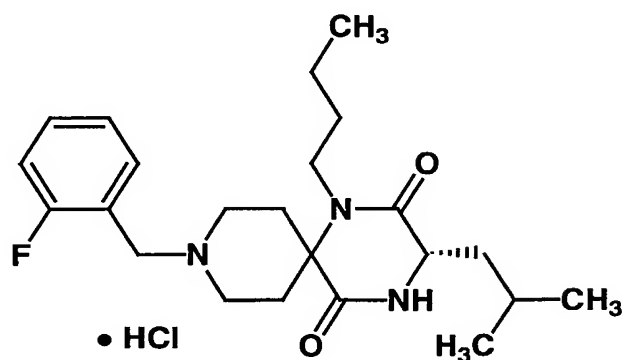
TLC : R_f 0.20 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.03-6.94 (m, 3H), 4.23 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.42-2.08 (m, 4H), 1.88-

1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (1 1)

- 5 (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

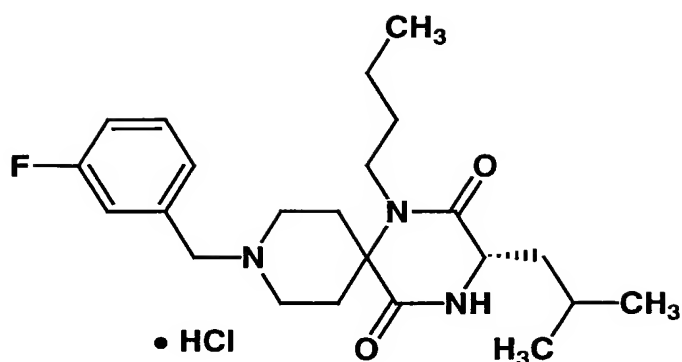


TLC : R_f 0.48 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.64-7.54 (m, 2H), 7.37-7.27 (m, 2H), 4.45 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.81 (m, 2H), 3.54 (m, 2H), 3.36 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 2.19 (m, 2H), 1.82-1.49 (m, 5H), 1.35 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

15 実施例 3 7 (1 2)

- (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

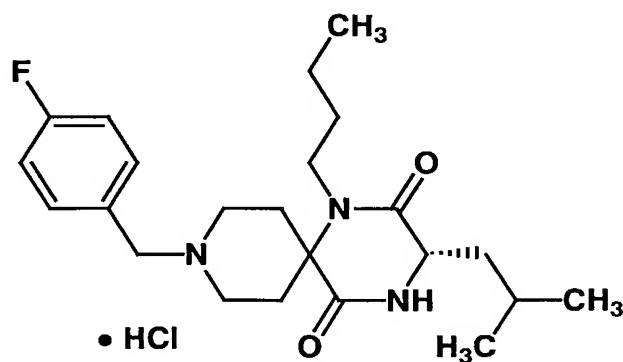


TLC : R_f 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (dt, J = 8.3, 6.0 Hz, 1H), 7.41-7.37 (m, 2H), 7.26 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 4.39 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.89-3.76 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 4H), 2.48-2.38 (m, 2H), 2.25-2.12 (m, 2H), 1.84-1.75 (m, 1H), 1.72-1.46 (m, 4H), 1.42-1.28 (m, 2H), 0.99-0.92 (m, 9H)。

実施例 37 (13)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 9-(4-フルオロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
 5]ウンデカン・塩酸塩



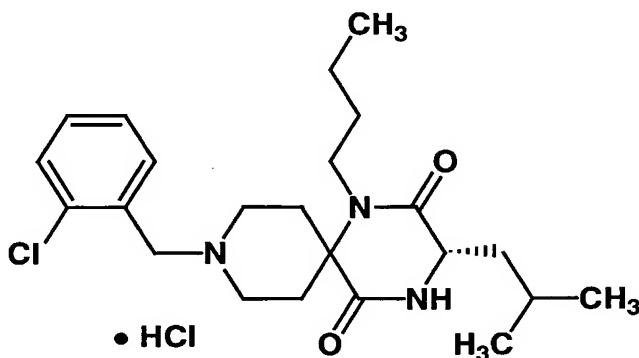
TLC : R_f 0.33 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.60 (dd, J = 8.7, 5.4 Hz, 2H), 7.24 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 3.99 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.49-3.35 (m, 4H), 2.44-2.13

(m, 4H), 1.84-1.46 (m, 5H), 1.37 (m, 2H), 0.99-0.95 (m, 9H)。

実施例 37 (14)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 5 9 - (2 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン・塩酸塩

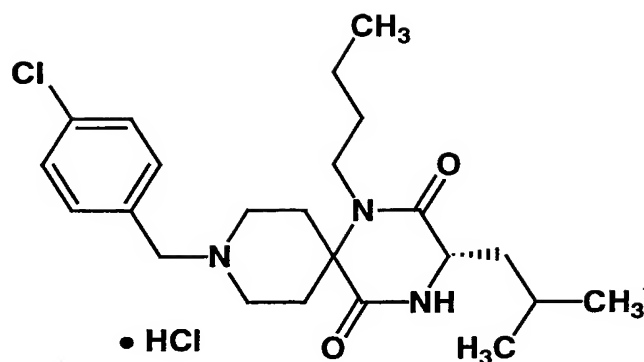


TLC : R_f 0.62 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.72 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H),
 10 7.56-7.45 (m, 2H), 4.55 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94 (m, 2H), 3.55
 (m, 2H), 3.42-3.32 (m, 2H), 2.43-2.37 (m, 2H), 2.26-2.13 (m, 2H), 1.85-1.46 (m,
 5H), 1.35 (m, 2H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 37 (15)

15 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (4 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン・塩酸塩

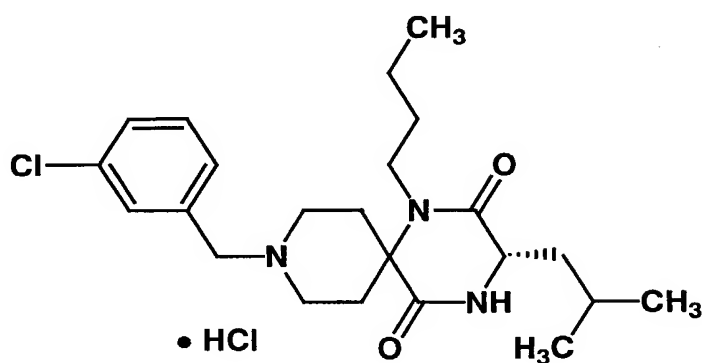


TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.55 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.51-3.34 (m, 4H), 2.49-2.52 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.44 (m, 5H), 1.44-1.29 (m, 2H), 1.00-0.89 (m, 9H)。

実施例 37 (16)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-クロロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



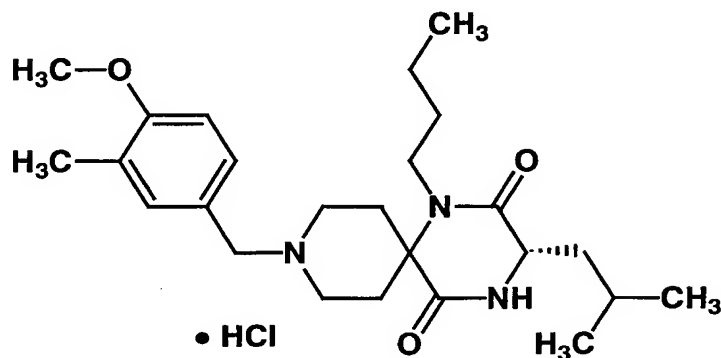
TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.68-7.64 (m, 1H), 7.56-7.45 (m, 3H), 4.37 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.91-3.72 (m, 2H), 3.54-3.32 (m, 4H), 2.53-2.34 (m, 2H),

2.27-2.08 (m, 2H), 1.90-1.44 (m, 5H), 1.44-1.27 (m, 2H), 0.99-0.89 (m, 9H)。

実施例 37 (17)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 5 9 - (3 - メチル - 4 - メトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザ
 スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

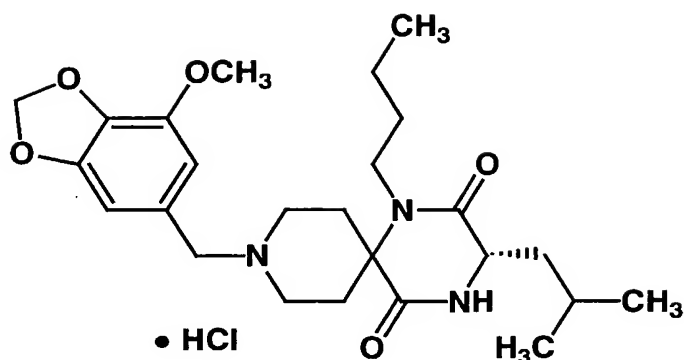


TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.38-7.30 (m, 2H), 6.99 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.25 (s, 2H),
 10 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.85-3.65 (m, 2H), 3.52-3.33 (m, 4H),
 2.50-2.30 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.20-2.07 (m, 2H), 1.90-1.43 (m, 5H), 1.43-1.28
 (m, 2H), 0.99-0.88 (m, 9H)。

実施例 37 (18)

15 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (7 - メトキシ - 1, 3 - ベンゾジオキソラン - 5 - イルメチル) - 1,
 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

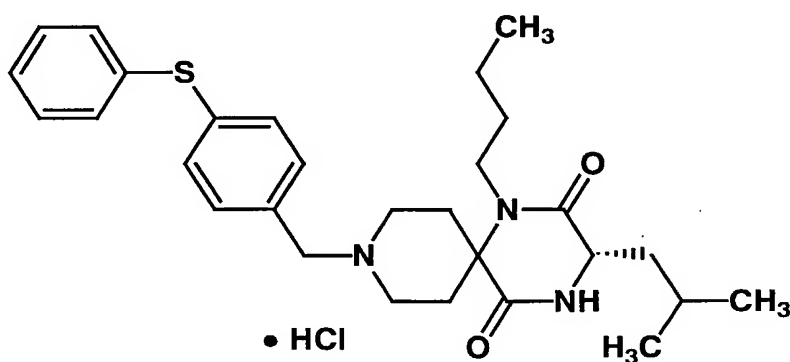


TLC : R_f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 6.85 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.74 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 5.99 (s, 2H), 4.25 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.87-3.66 (m, 2H),
 5 3.52-3.32 (m, 4H), 2.52-2.34 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.43 (m, 5H),
 1.43-1.29 (m, 2H), 0.99-0.90 (m, 9H)。

実施例 37 (19)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 10 9-(4-フェニルチオフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
 5]ウンデカン・塩酸塩



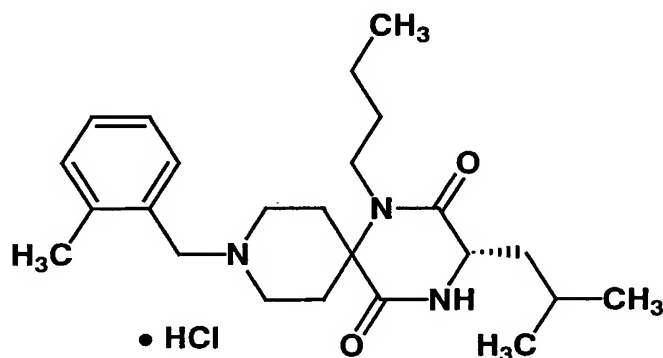
TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50-7.36 (m, 7H), 7.30 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H),
 15 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.53-3.32 (m, 4H), 2.50-2.30 (m,

2H), 2.26-2.06 (m, 2H), 1.90-1.42 (m, 5H), 1.42-1.27 (m, 2H), 0.98-0.89 (m, 9H)。

実施例 37 (20)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 5 9 - (2 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン・塩酸塩

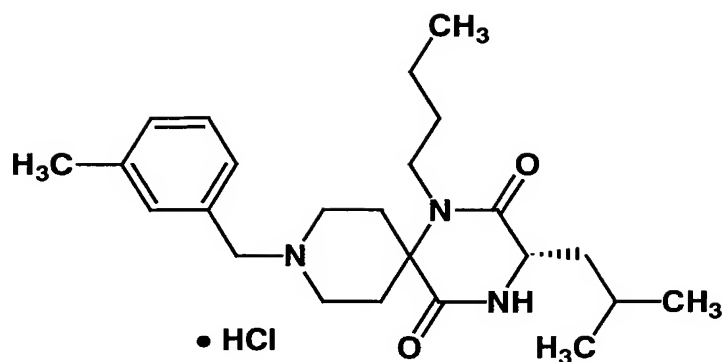


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.42-7.28 (m, 3H), 4.41 (s, 2H),
 10 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.89 (m, 2H), 3.53 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.48 (s,
 3H), 2.48 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 1.90-1.42 (m, 5H), 1.36 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H),
 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (21)

15 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (3 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン・塩酸塩

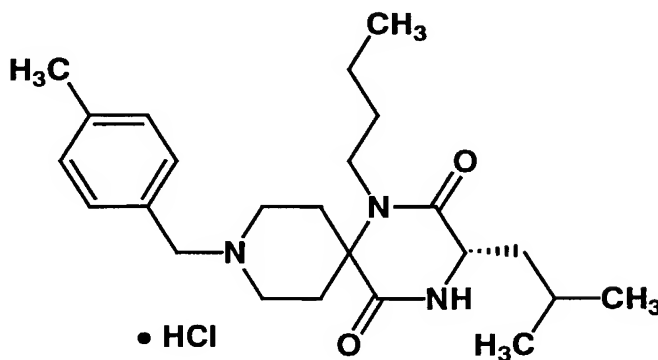


TLC : R_f 0.31 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.41-7.29 (m, 4H), 4.31 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.79 (m, 2H), 3.52-3.34 (m, 4H), 2.40 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.17 (m, 2H),
 5 1.90-1.44 (m, 5H), 1.36 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (22)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 10 9-(4-メチルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]
 ウンデカン・塩酸塩



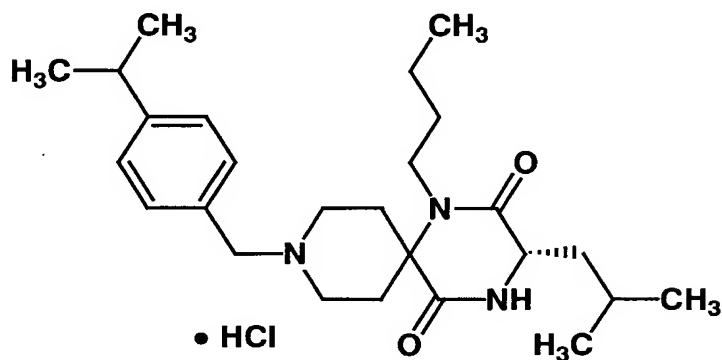
TLC : R_f 0.31 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.43 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.31 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.52-3.35 (m, 4H), 2.40 (m,
 15 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.52-3.35 (m, 4H), 2.40 (m,

2H), 2.37 (s, 3H), 2.17 (m, 2H), 1.88-1.44 (m, 5H), 1.36 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (23)

- 5 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (1 - メチルエチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



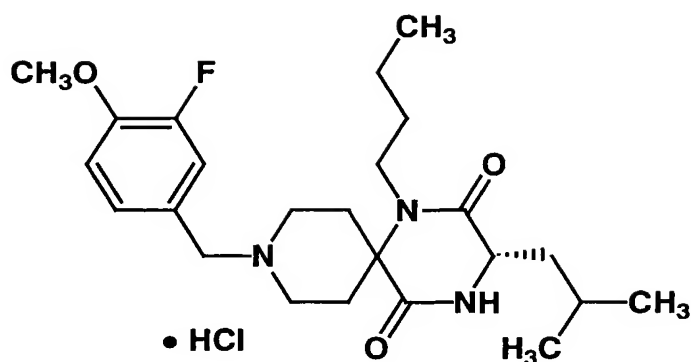
TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.70 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 4H), 3.04-2.88 (m, 1H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 1.26 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.9 Hz, 3H)。

15

実施例 37 (24)

- (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



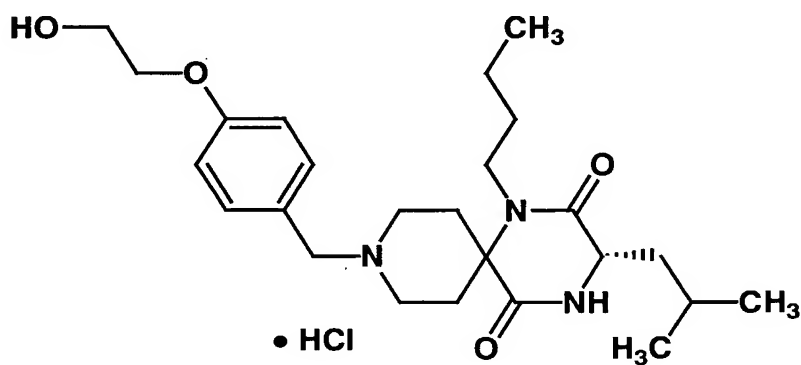
TLC : R f 0.44 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.32 (m, 2H), 7.21 (m, 1H), 4.31 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.86-3.64 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.56-2.32

5 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.90-1.26 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

实施例 37 (25)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 10 9 - (4 - (2 - ヒドロキシエチルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9
 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



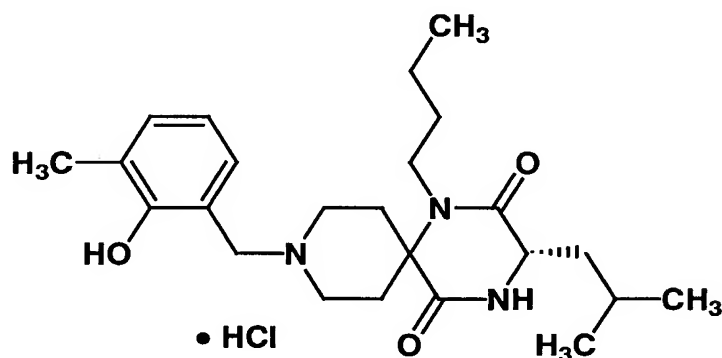
TLC : R f 0.22 (クロロホルム：メタノール＝10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.09 (t, J = 5.1 Hz, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88 (t, J = 5.1 Hz,

2H), 3.86-3.64 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 4H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5 実施例 37 (26)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - ヒドロキシ - 3 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

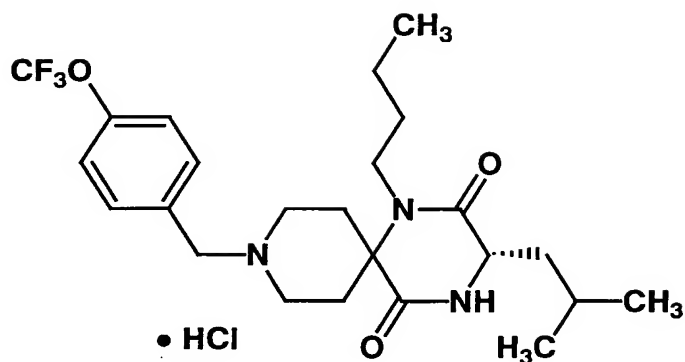


- 10 TLC : R_f 0.66 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.24 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 6.89 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.76 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.44-2.08 (m, 4H), 2.89 (s, 3H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

15

実施例 37 (27)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - トリフルオロメチルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

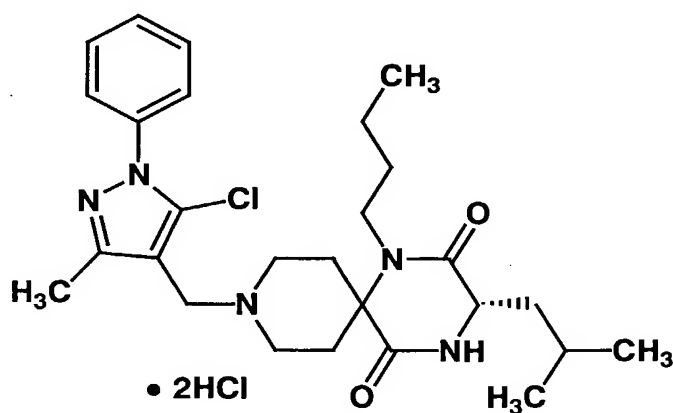


TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.71 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.56-2.36 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (28)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - メチル - 5 - クロロ - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



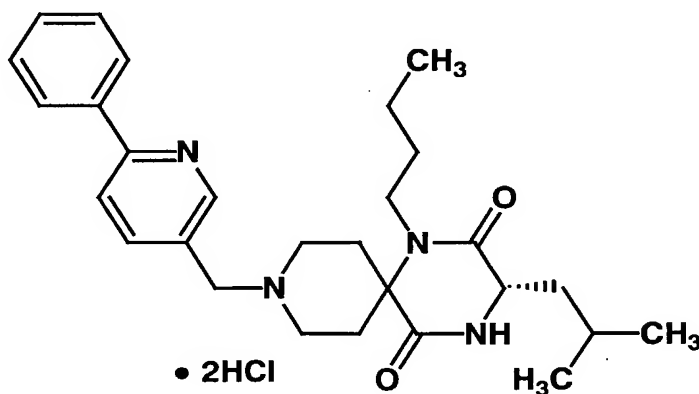
TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.50 (m, 5H), 4.35 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz,

1H), 3.98-3.80 (m, 2H), 3.72-3.58 (m, 2H), 3.46-3.38 (m, 2H), 2.58-2.38 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.36-2.18 (m, 2H), 1.92-1.24 (m, 7H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5 実施例 37 (29)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルピリジン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

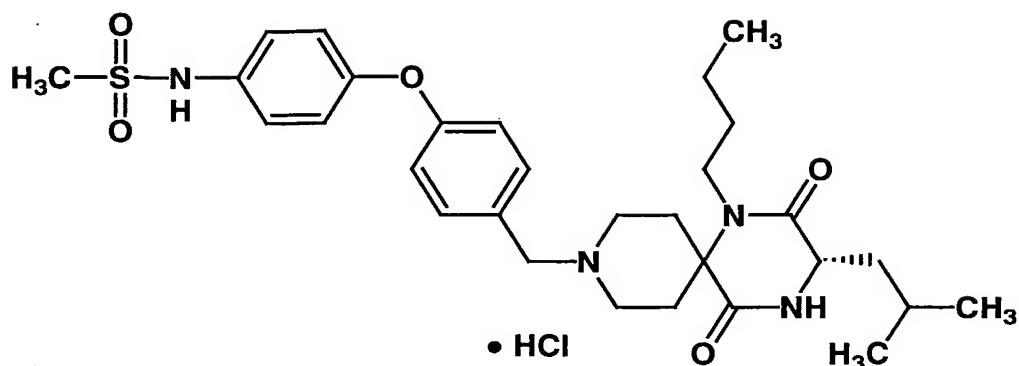


- 10 TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 9.17 (s, 1H), 8.80 (m, 1H), 8.39 (m, 1H), 8.03-7.97 (m, 2H), 7.73-7.65 (m, 3H), 4.65 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.2, 4.2 Hz, 1H), 4.02-3.82 (m, 2H), 3.64-3.42 (m, 2H), 3.78-3.56 (m, 2H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H), 0.96 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

15

実施例 37 (30)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

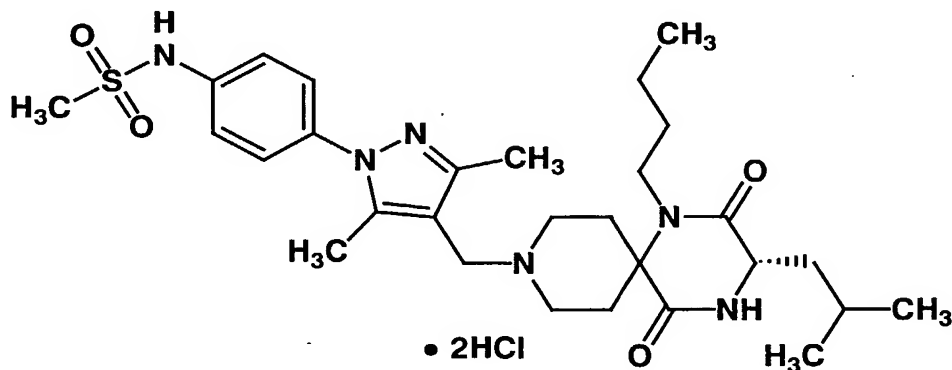


TLC : R_f 0.18 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.08 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H),
 5 3.88-3.68 (m, 2H), 3.56-3.35 (m, 4H), 2.96 (s, 3H), 2.50-2.08 (m, 4H), 1.88-1.26 (m, 7H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (31)

- 10 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

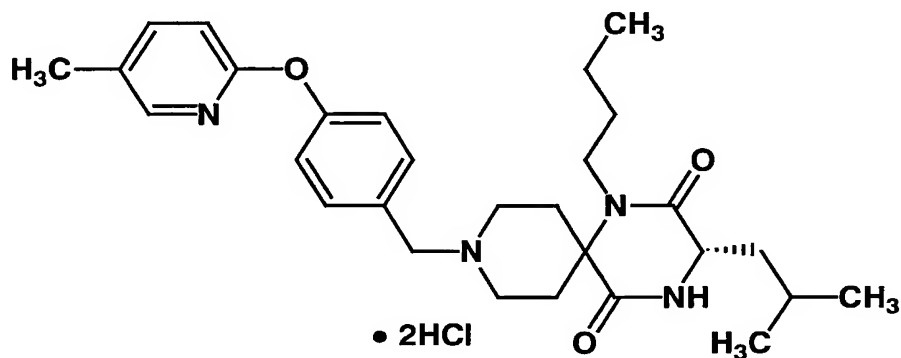


- 15 TLC : R_f 0.15 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.49 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.76 (m, 2H), 3.66-3.58 (m, 2H), 3.56-3.42 (m, 2H), 3.05 (s, 3H), 2.68-2.46 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.32-2.10 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.97 (t, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.3 Hz, 3H),
 5 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (3 2)

(3 S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (4 - (5 - メチルピリジン - 2 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1 ,
 10 4 , 9 - トリアザスピロ [5 . 5] ウンデカン ・ 2 塩酸塩

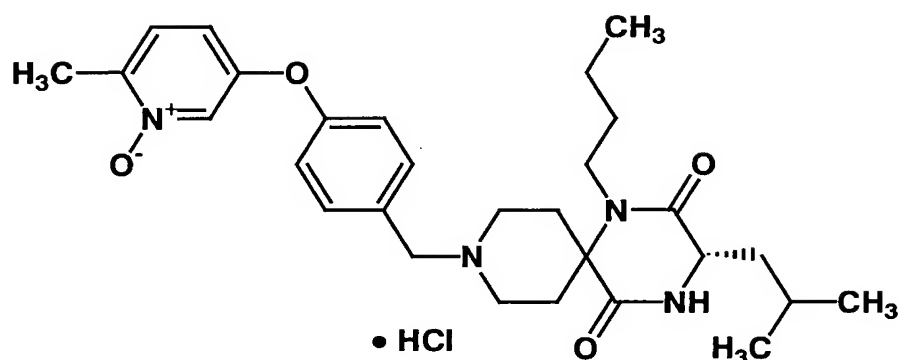


TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.12 (s, 1H), 7.93 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.06 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.40 (s, 2H), 4.03 (dd, J =
 15 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.94-3.76 (m, 2H), 3.58-3.40 (m, 4H), 2.56-2.36 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 3 7 (3 3)

(3 S) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 1 - オキシド - 3 - イルオキシ) フェニ

ルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

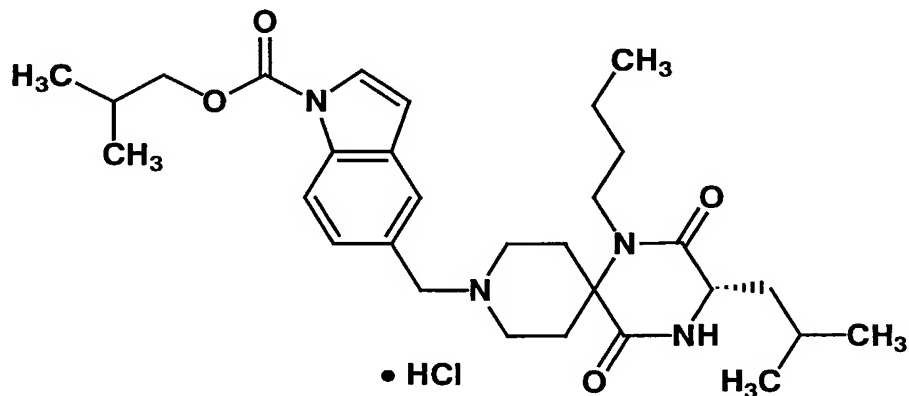


TLC : R_f 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.47 (s, 1H), 7.71 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.62 - 7.48 (m, 2H),
 5 7.29 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.72 (m,
 2H), 3.58-3.38 (m, 4H), 2.64-2.40 (m, 2H), 2.60 (s, 3H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.90-
 1.28 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz,
 3H)。

10 実施例 37 (34)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (1 - (2 - メチルプロピルオキシカルボニル) インドール - 5 - イル
 メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

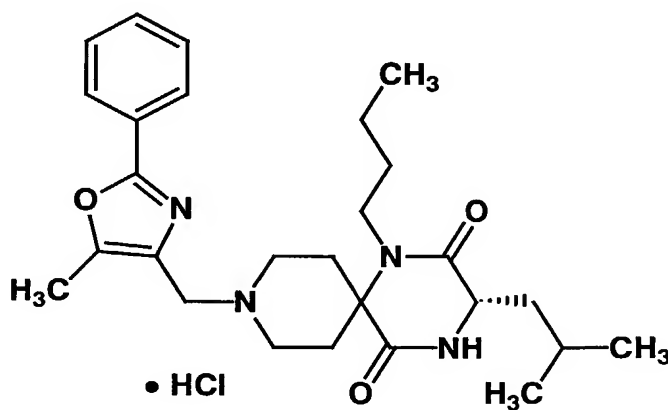


TLC : R_f 0.23 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.16 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.4, 1.5 Hz, 1H), 6.75 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.46 (s, 2H), 4.27 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.82-3.74 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 3H), 1.88-1.24 (m, 7H), 1.09 (s, 3H), 1.06 (s, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (35)

- 10 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - フェニル - 5 - メチルオキサゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

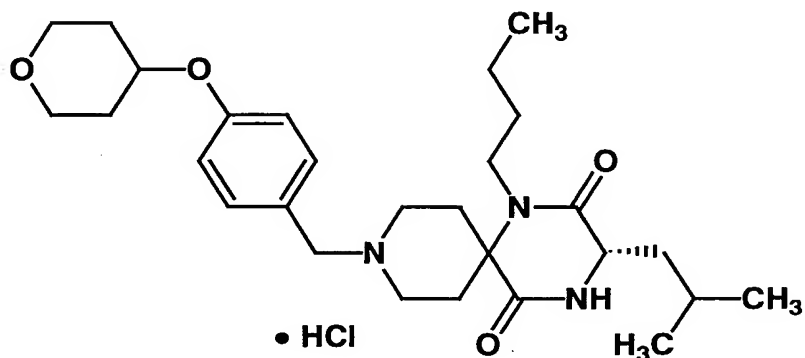


TLC : R_f 0.32 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 15 NMR (CD₃OD) : δ 8.05-8.02 (m, 2H), 7.52-7.50 (m, 3H), 4.35 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.80 (m, 2H), 3.70-3.58 (m, 2H), 3.44-3.38 (m, 2H), 2.53 (s, 3H), 2.53-2.36 (m, 2H), 2.34-2.14 (m, 2H), 1.90-1.26 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

20 実施例 37 (36)

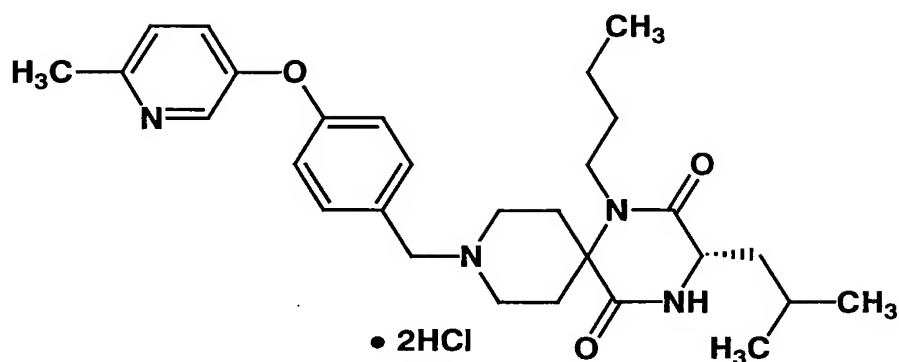
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
9-(4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1,
4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



- 5 TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.64 (m, 1H), 4.29 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.91 (m, 2H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.64-3.56 (m, 2H), 3.50-3.37 (m, 4H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.24-1.98 (m, 4H), 1.88-1.26 (m, 9H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J =
10 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (37)

- (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
9-(4-(6-メチルピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1,
15 4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

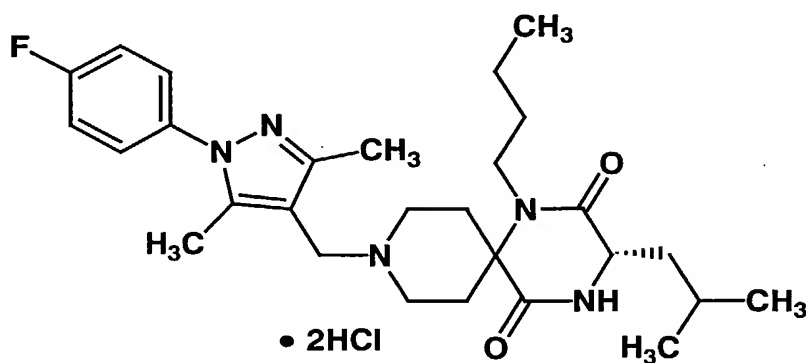


TLC : R_f 0.22 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.55 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.10 (dd, J = 9.0, 2.7 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H),
 5 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.70 (m, 2H), 3.58-3.38 (m, 4H), 2.74 (s, 3H),
 2.60-2.42 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.90-1.26 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H),
 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (38)

10 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾール - 4 -
 イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩酸
 塩



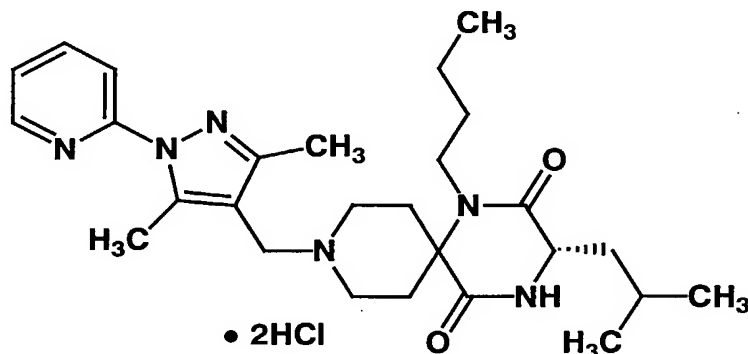
15 TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.55-7.46 (m, 2H), 7.36-7.25 (m, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.73 (m, 2H), 3.66-3.55 (m, 2H), 3.52-3.40 (m, 2H), 2.63-2.45 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.90-1.43 (m, 5H), 1.43-1.30 (m, 2H), 0.99-0.91 (m, 9H)。

5

実施例 37 (39)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (ピリジン - 2 - イル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



10

TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.55 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.12 (dd, J = 8.4, 7.2 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.73 (m, 2H), 3.67-3.55 (m, 2H), 3.54-3.40 (m, 2H), 2.69 (s, 3H), 2.70-2.48 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.92-1.43 (m, 5H), 1.43-1.26 (m, 2H), 0.99-0.90 (m, 9H)。

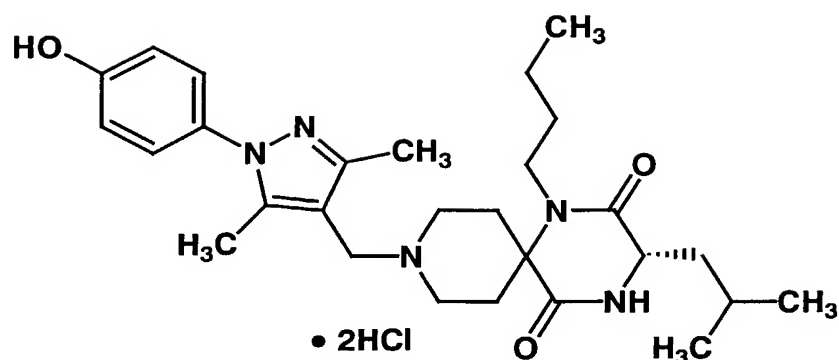
15

実施例 37 (40)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - ヒドロキシフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩

20

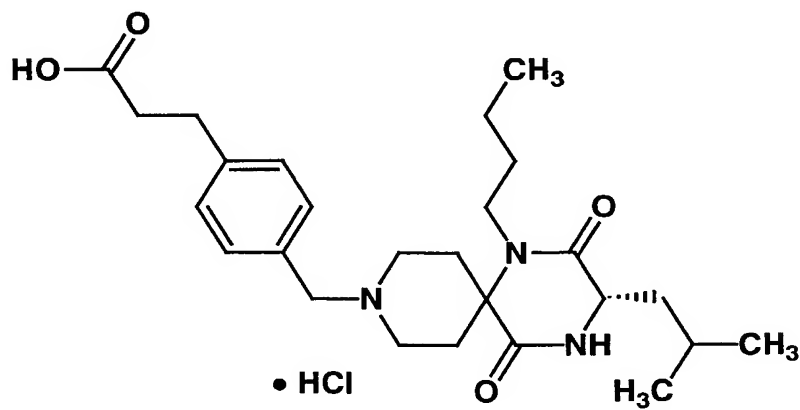
酸塩

TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.30 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.95 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H),
 5 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.77 (m, 2H), 3.61 (m, 2H), 3.47 (m, 2H),
 2.58 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.20 (m, 2H), 1.88-1.76 (m, 1H), 1.73-
 1.32 (m, 6H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz,
 3H)。

10 実施例 37 (41)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (4 - (2 - カルボキシエチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリ
 アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

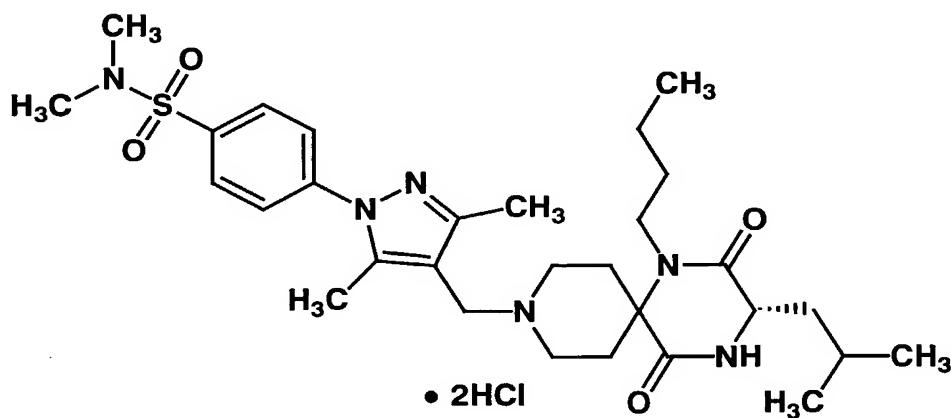


TLC : R f 0.38 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD): δ 7.47 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.37 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.73 (m, 2H), 3.49-3.35 (m, 4H), 2.96 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.62 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.44-2.33 (m, 2H), 2.23-2.11 (m, 2H), 1.84-1.32 (m, 7H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

实施例 3 7 (4 2)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 10 9-(3,5-ジメチル-1-(4-(ジメチルアミノスルホニル)フェニ
 ル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]
 ウンデカン・2塩酸塩

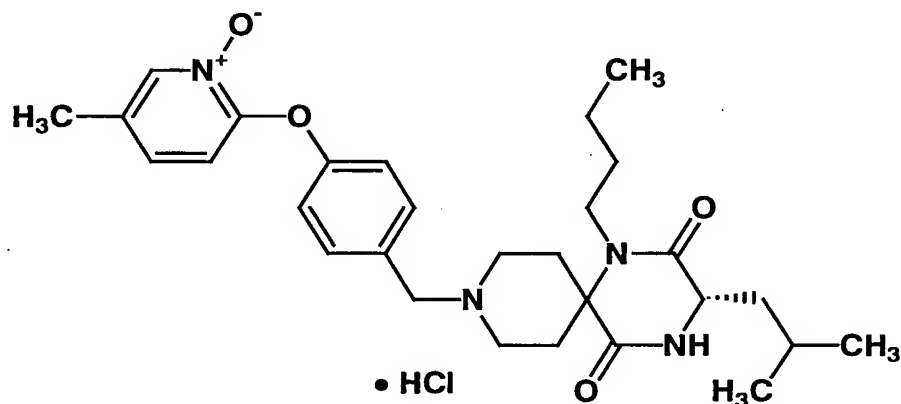


TLC : Rf 0.54 (クロロホルム：メタノール=9：1) ;

15 NMR (CD₃OD) : δ 7.96 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.77 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.95-3.75 (m, 2H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.47 (m, 2H), 2.74 (s, 6H), 2.56 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.30-2.12 (m, 2H), 1.90-1.46 (m, 5H), 1.38 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 0.98-0.93 (m, 9H)。

20 实施例 3 7 (4 3)

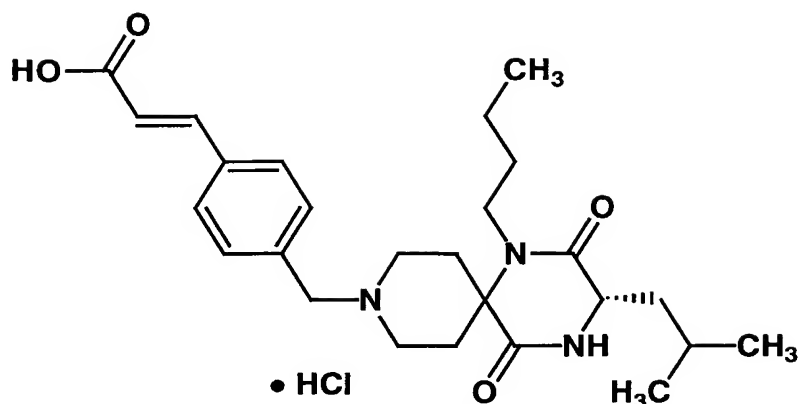
(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
9-(4-(5-メチルピリジン-1-オキシド-2-イルオキシ)フェニ
ルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



- 5 TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 7.77 (brs, 1H), 7.65-7.59 (m, 2H), 7.56 (dd, J = 9.3, 2.4 Hz, 1H), 7.03-6.97 (m, 2H), 6.73 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.33 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.68 (m, 2H), 3.51-3.36 (m, 4H), 2.46 (m, 2H), 2.25-2.07 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.90-1.44 (m, 5H), 1.36 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 0.97-0.91 (m, 9H)。

実施例 37 (44)

- (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
9-(4-(2-カルボキシ-1-エテニル)フェニルメチル)-1,4,
15 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

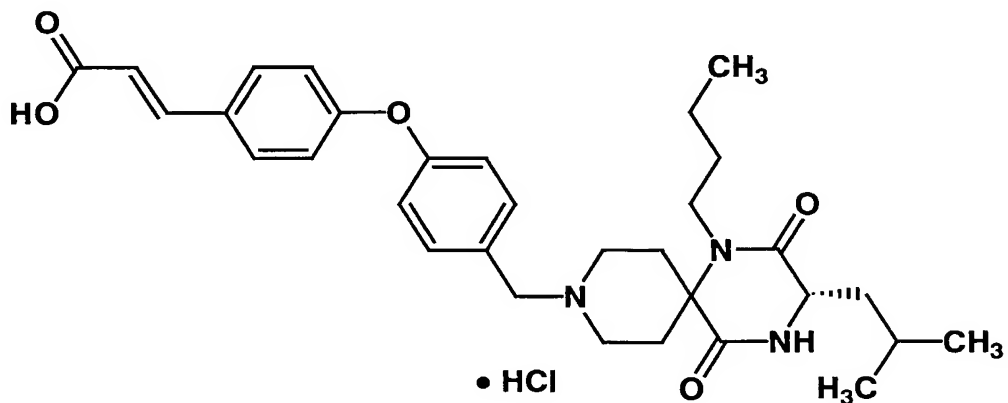


TLC : R_f 0.20 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.70 (d, J = 16.2 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.58 (d, J = 16.2 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.74 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (45)

- 10 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - (2 - カルボキシ - 1 - エテニル) フェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



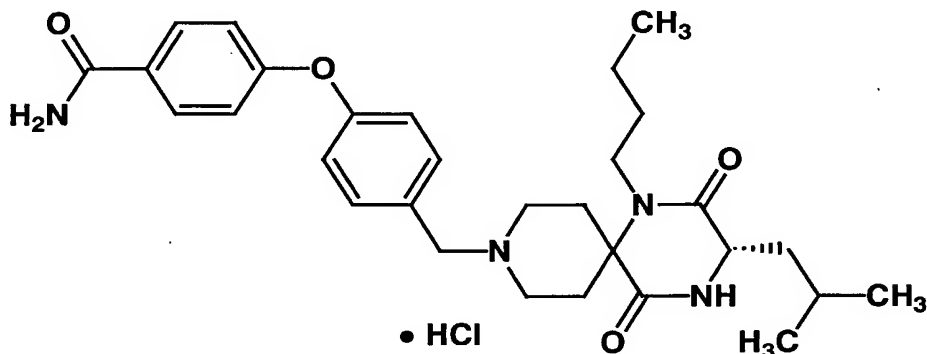
TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.69-7.57 (m, 5H), 7.14 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.05 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.42 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.70 (m, 2H), 3.56-3.35 (m, 4H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.30-2.12 (m, 2H), 1.88-1.25 (m, 7H), 0.98-0.88 (m, 9H)。

5

実施例 37 (46)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - アミノカルボニルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

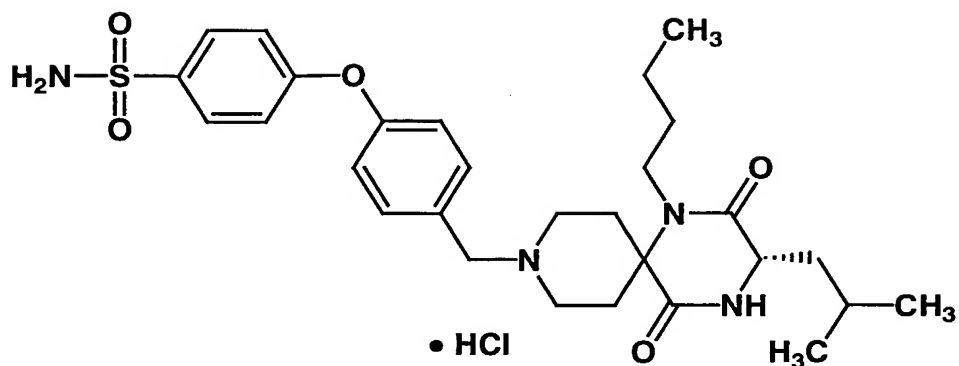
NMR (CD₃OD) : δ 7.90 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.58-3.35 (m, 4H), 2.54-2.36 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.90-1.26 (m, 7H), 1.00-0.86 (m, 9H)。

15

実施例 37 (47)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - アミノスルホニルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

20

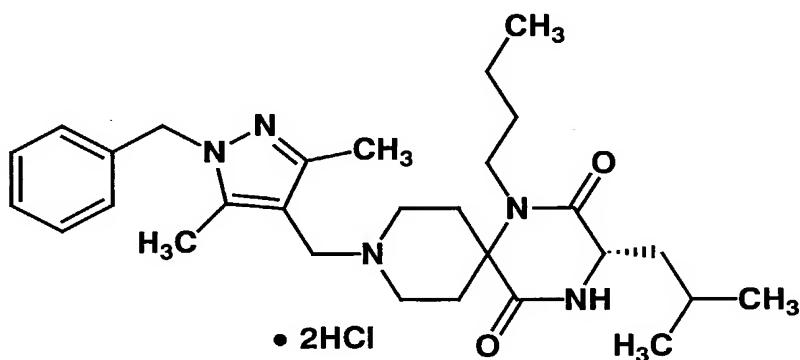


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.90 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.57 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.28 (brs, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5, Hz, 1H), 3.83-3.60 (m, 2H), 3.49-3.34 (m, 4H), 2.44-2.26 (m, 2H), 2.26-2.09 (m, 2H), 1.89-1.26 (m, 7H), 1.00-0.88 (m, 9H)。

実施例 37 (48)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - ベンジルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1,
 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



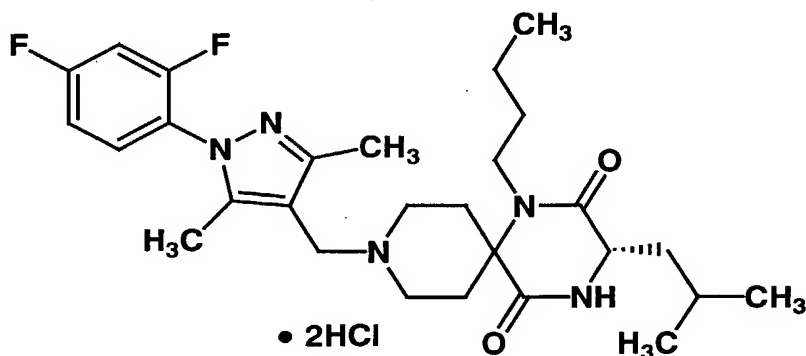
TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.41-7.33 (m, 3H), 7.21-7.19 (m, 2H), 5.45 (s, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.89-3.73 (m, 2H), 3.60-3.46 (m, 4H), 2.61

(m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.23-2.11 (m, 2H), 1.87-1.31 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 37 (49)

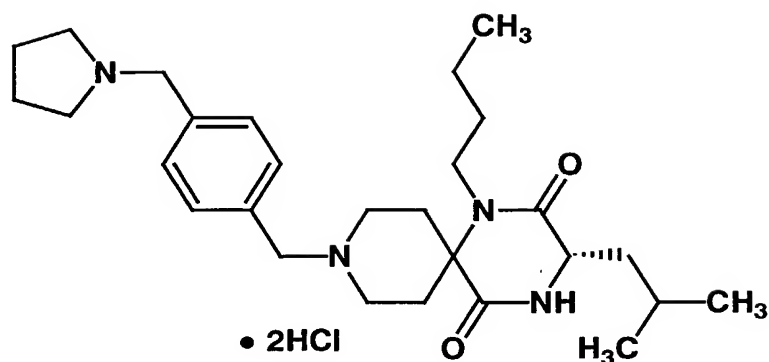
- 5 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



- 10 T L C : R f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.53 (m, 1H), 7.33-7.26 (m, 1H), 7.23-7.16 (m, 1H), 4.31 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.76 (m, 2H), 3.63-3.56 (m, 2H), 3.49-3.45 (m, 2H), 2.57 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.19 (m, 2H), 1.86-1.34 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。
 15

実施例 37 (50)

- (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩
 20

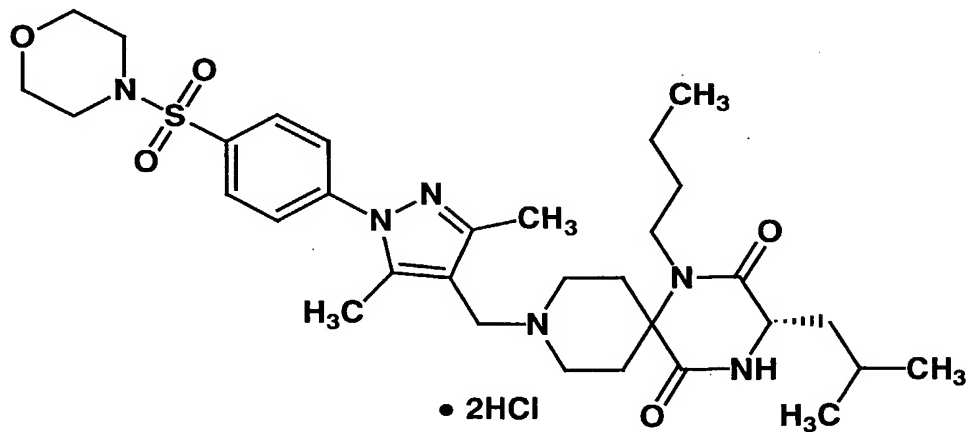


TLC : R_f 0.10 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.65 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.70 (m, 2H), 3.56-3.40 (m, 5 6H), 3.25-3.12 (m, 2H), 2.68-2.48 (m, 2H), 2.28-1.95 (m, 6H), 1.88-1.42 (m, 5H), 1.42-1.30 (m, 2H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

实施例 37 (51)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 10 9-(3, 5-ジメチル-1-(4-(モルホリン-4-イルスルホニル)
 フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.
 5]ウンデカン・2塩酸塩

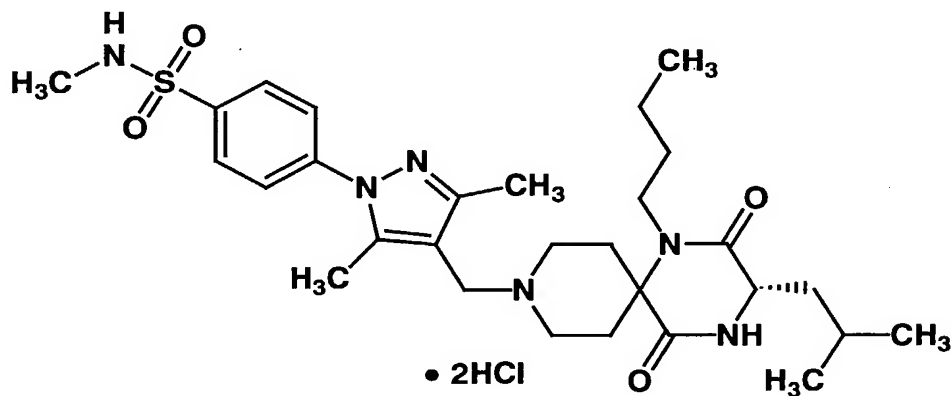


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム：メタノール=20：1)；

NMR (CD₃OD) : δ 7.95 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.80 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.95-3.72 (m, 2H), 3.76-3.67 (m, 4H), 3.66-3.57 (m, 2H), 3.56-3.42 (m, 2H), 3.08-2.95 (m, 4H), 2.70-2.50 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.31-2.10 (m, 2H), 1.90-1.44 (m, 5H), 1.44-1.30 (m, 2H), 1.00-0.91 (m, 9H)。

実施例 37 (52)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (メチルアミノスルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩酸塩

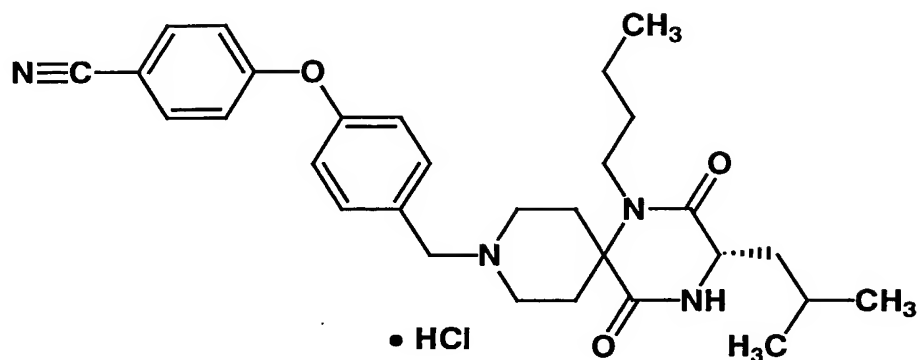


TLC : R_f 0.21 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.01 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.73 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.98-3.78 (m, 2H), 3.66-3.58 (m, 2H), 3.44-3.30 (m, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.54-2.38 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.36-2.16 (m, 2H), 1.90-1.26 (m, 7H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 6H)。

実施例 37 (53)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -

9 - (4 - (4 - シアノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 -
トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



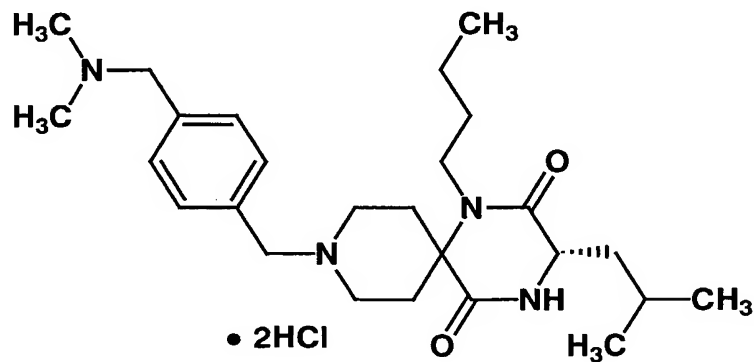
TLC : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

5 NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.21 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.14 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.72 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.58-2.38 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

10

実施例 37 (54)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (4 - (ジメチルアミノメチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



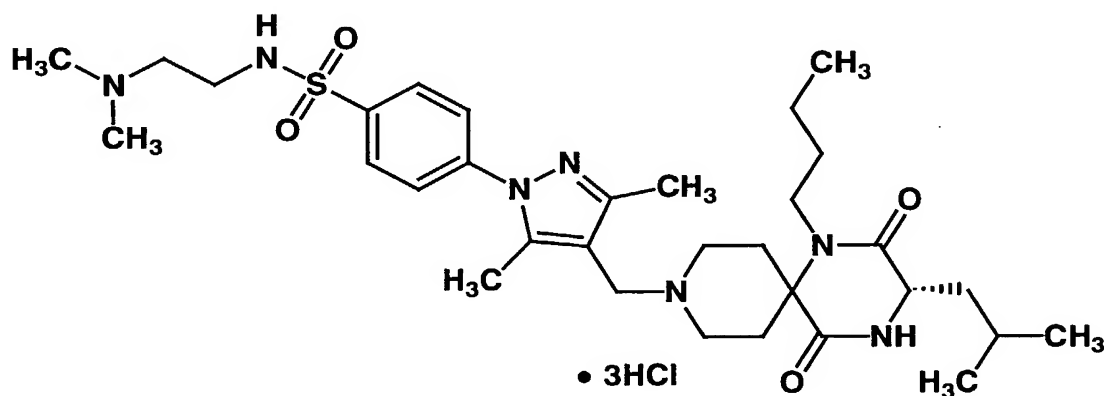
15

TLC : Rf 0.16 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.76 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.63 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.50-3.42 (m, 4H), 2.87 (s, 6H), 2.65-2.50 (m, 2H), 2.22-2.04 (m, 2H), 1.88-1.32 (m, 7H), 0.97-0.92 (m, 9H)。

実施例 37 (55)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (2 - ジメチルアミノエチルアミノスルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・3 塩酸塩



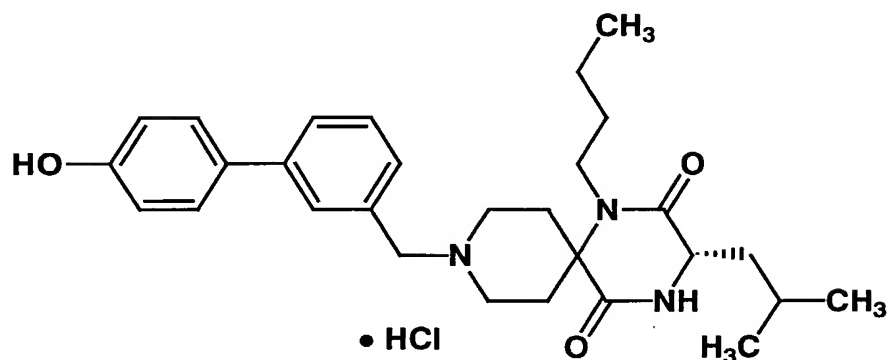
TLC : Rf 0.13 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.78 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 8.1, 5.1 Hz, 1H), 3.95-3.74 (m, 2H), 3.68-3.45 (m, 4H), 3.40-3.20 (m, 4H), 2.95 (s, 6H), 2.70-2.50 (m, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.28-2.12 (m, 2H), 1.88-1.34 (m, 7H), 0.98-0.92 (m, 9H)。

実施例 37 (56)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -

9- (3- (4-ヒドロキシフェニル) フェニルメチル) -1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



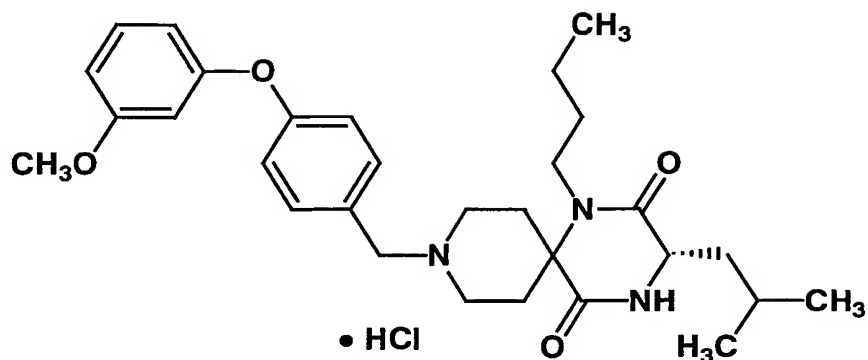
TLC : R_f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

5 NMR (CD₃OD) : δ 7.81 (s, 1H), 7.69 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.55-7.48 (m, 1H), 7.45 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.73 (m, 2H), 3.56-3.44 (m, 2H), 3.44-3.30 (m, 2H), 2.53-2.33 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.40 (m, 5H), 1.43-1.25 (m, 2H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.3 Hz, 3H).

10

実施例 37 (57)

(3S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) -
9- (4- (3-メトキシフェニルオキシ) フェニルメチル) -1, 4, 9-
15 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

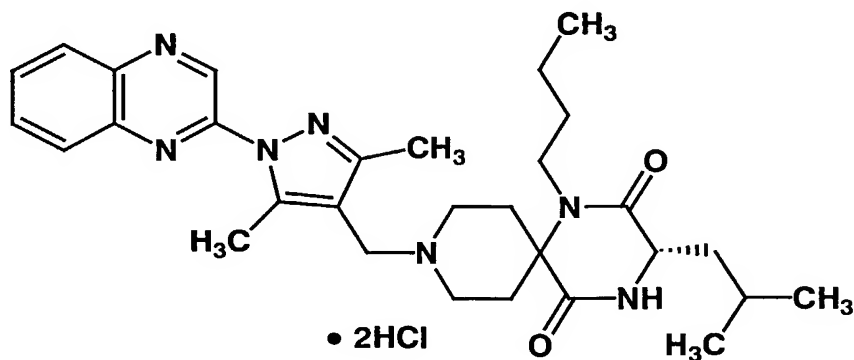


TLC : R_f 0.54 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.28 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 6.75 (ddd, J = 8.3, 2.3, 1.0 Hz, 1H), 6.60-6.57 (m, 2H), 4.33 (s, 2H),
 5 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.73 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.51-3.34 (m, 4H),
 2.41 (m, 2H), 2.42-2.12 (m, 2H), 1.84-1.33 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.94
 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 37 (58)

- 10 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (キノキサリン - 2 - イル) ピラゾール - 4
 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩
 酸塩

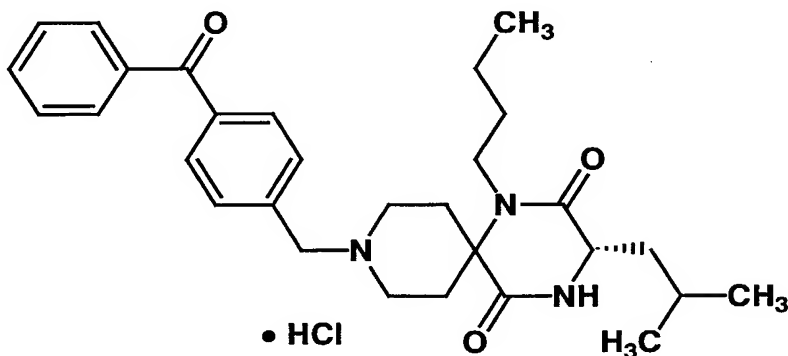


- 15 TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 9.51 (s, 1H), 8.12 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 8.0 Hz, 1H),
 7.90-7.80 (m, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.81 (m, 2H),
 3.63 (m, 2H), 3.44 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.47 (s, 3H), 2.47 (m, 2H), 2.29-2.17
 (m, 2H), 1.86-1.33 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.5 Hz, 3H),
 5 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 37 (59)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 9 - (4 - フェニルカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザス
 10 ピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

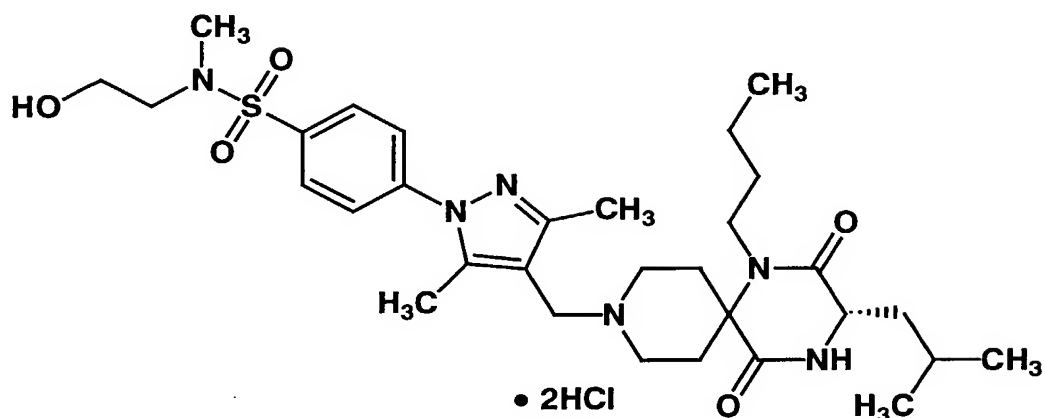


TLC : R_f 0.76 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.88 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.81-7.67 (m, 5H), 7.57-7.52 (m,
 2H), 4.49 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 8.1, 4.8 Hz, 1H), 4.00-3.78 (m, 2H), 3.59-3.48 (m,
 15 2H), 3.44-3.35 (m, 2H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.32-2.14 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H),
 1.02-0.88 (m, 9H)。

実施例 37 (60)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
 20 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (N - (2 - ヒドロキシエチル) - N
 - メチルアミノスルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1,

4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

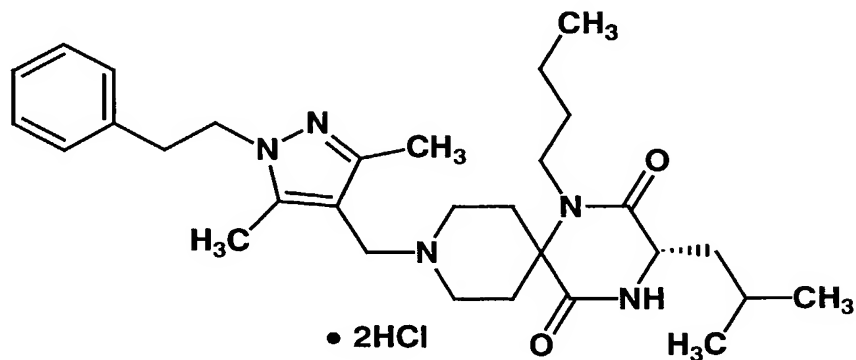


TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.00 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.76 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.76 (m, 2H), 3.70 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 3.68-3.58 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 2H), 3.20 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 2.88 (s, 3H), 2.58-2.38 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.36-2.16 (m, 2H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.97 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

10 実施例 37 (61)

(3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(2-フェニルエチル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

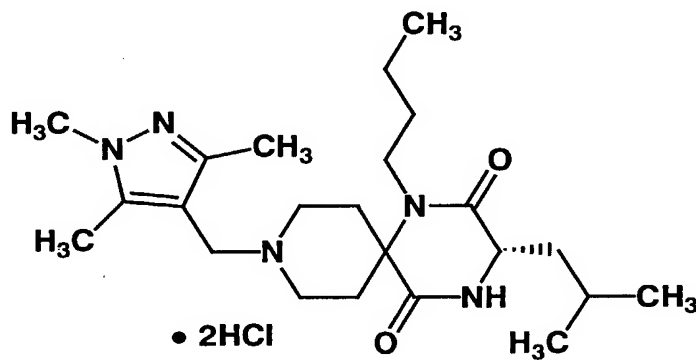


TLC : Rf 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.31-7.23 (m, 3H), 7.10 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.44 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 4.21 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.82-3.60 (m, 2H), 3.58-3.32 (m, 4H), 3.13 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 2.72-2.52 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.24-2.04 (m, 2H), 1.99 (s, 3H), 1.90-1.36 (m, 7H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (62)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
9-(1,3,5-トリメチルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-
トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

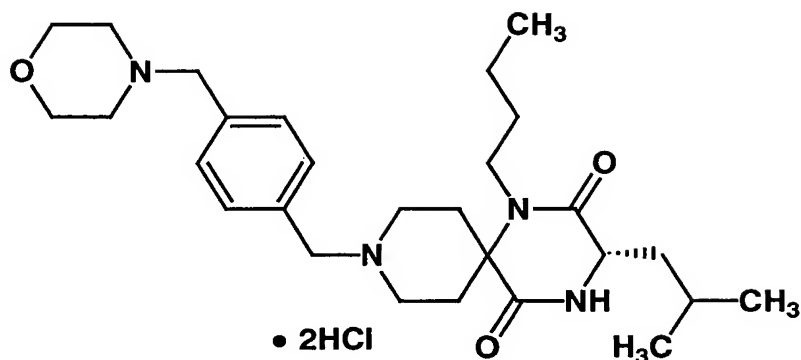


TLC : Rf 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.28 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.87 (s, 3H),
3.87-3.69 (m, 2H), 3.60-3.43 (m, 4H), 2.69-2.50 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.44 (s,
3H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.98-0.85 (m, 9H)。

実施例 37 (63)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
9-(4-(モルホリン-4-イルメチル)フェニルメチル)-1,4,9-
トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

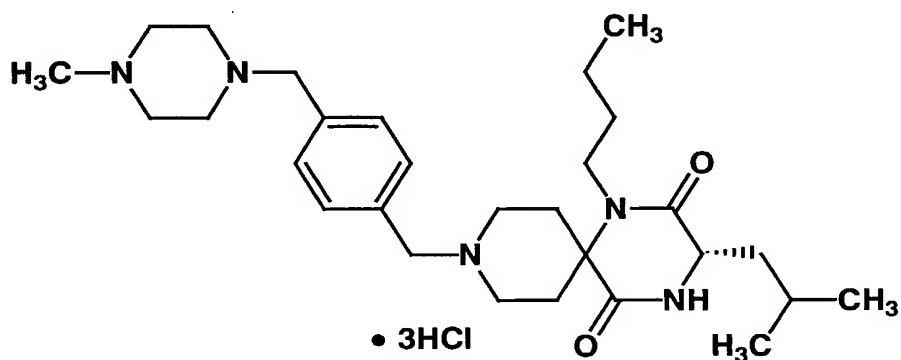


TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.74 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40 (s, 4H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 4.10-3.70 (m, 6H), 3.54-3.42 (m, 4H), 3.40-3.16 (m, 4H), 2.65-2.46 (m, 2H), 2.24-2.03 (m, 2H), 1.88-1.28 (m, 7H), 1.02-0.88 (m, 9H)。

実施例 37 (64)

(3S)-1-(4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)benzyl)-2,5-dioxo-3-(2-methylpropyl)-9-(4-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)phenylmethyl)-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecan-3-ylidene-3-hydrochloride



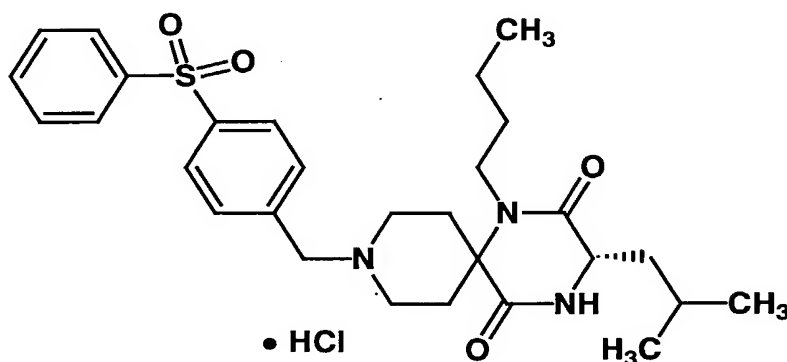
TLC : R_f 0.64 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.45 (m, 4H), 4.55 (s, 2H), 4.42 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.56 (m, 10H), 3.53-3.43 (m, 4H), 3.01 (s, 3H), 2.59-2.47 (m,

2H), 2.22-2.09 (m, 2H), 1.85-1.33 (m, 7H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.5 Hz, 3H)。

実施例 37 (65)

- 5 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルスルホニルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

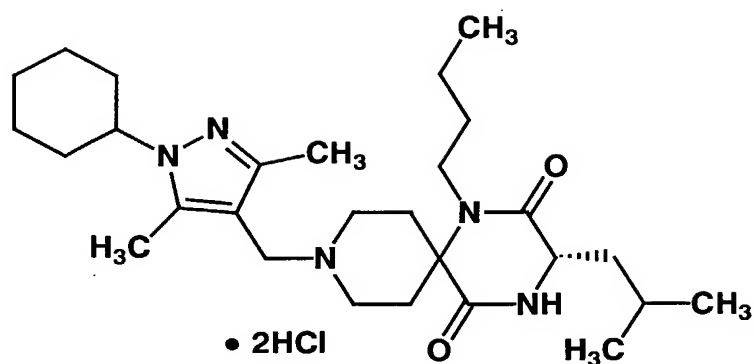


TLC : R_f 0.70 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 8.08 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.02-7.96 (m, 2H), 7.80 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.70-7.55 (m, 3H), 4.43 (s, 2H), 3.99 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.91-3.72 (m, 2H), 3.48-3.34 (m, 4H), 2.48-2.32 (m, 2H), 2.23-2.06 (m, 2H), 1.88-1.43 (m, 5H), 1.34 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 0.96-0.90 (m, 9H)。

15 実施例 37 (66)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - シクロヘキシルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



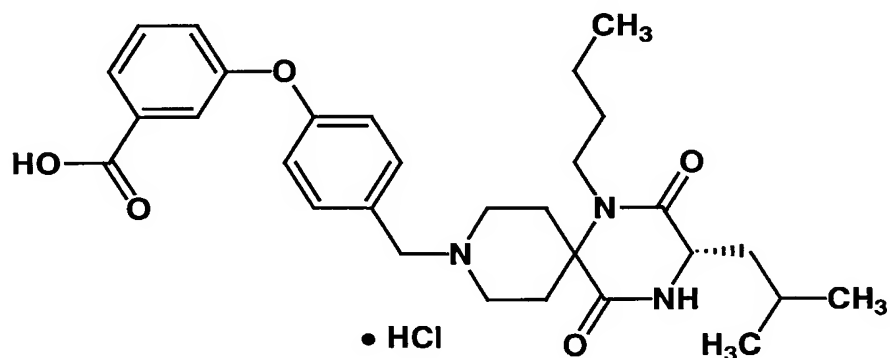
TLC : R_f 0.28 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.35-4.20 (m, 3H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.68 (m, 2H), 3.58-3.41 (m, 4H), 2.60-2.46 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.26-

5 2.08 (m, 2H), 1.98-1.26 (m, 17H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

実施例 37 (67)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (4 - (3 - カルボキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4,
10 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.11 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

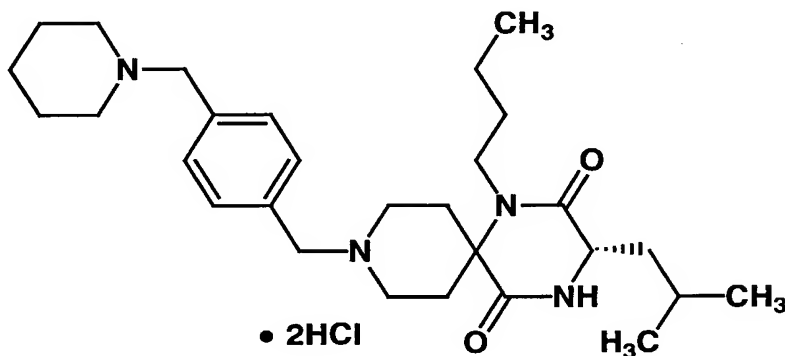
NMR (CD₃OD) : δ 7.83 (ddd, J = 7.8, 1.5, 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 2.4, 1.5 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.51 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.29 (ddd, J = 7.8, 2.4, 0.9

15 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.35 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H),

3.90-3.72 (m, 2H), 3.57-3.36 (m, 4H), 2.50-2.34 (m, 2H), 2.28-2.09 (m, 2H),
1.89-1.44 (m, 5H), 1.36 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 0.98-0.91 (m, 9H)。

実施例 37 (68)

- 5 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (4 - (ピペリジン - 1 - イルメチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9
- トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

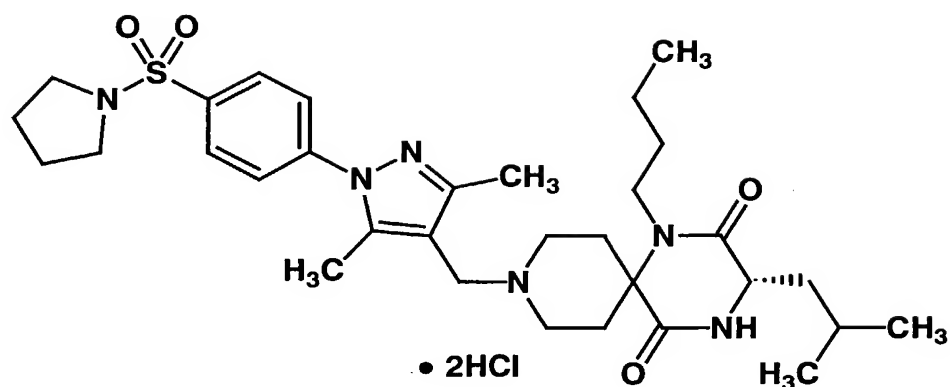


TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.65 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.91-3.71 (m, 2H), 3.54-3.41 (m, 6H), 3.05-2.91 (m, 2H), 2.67-2.49 (m, 2H), 2.25-2.05 (m, 2H), 2.00-1.28 (m, 13H); 0.98-0.91 (m, 9H)。

15 実施例 37 (69)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (ピロリジン - 1 - イルスルホニル)
フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン・2 塩酸塩

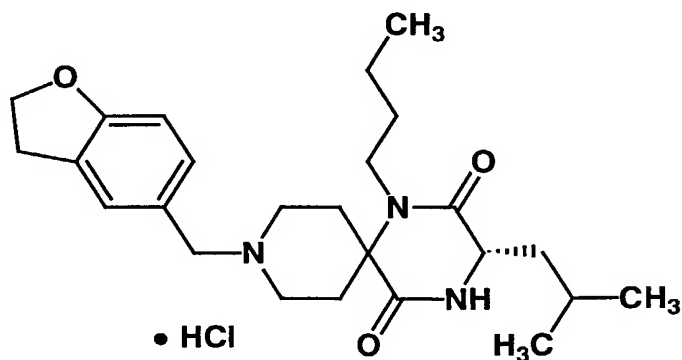


TLC : R_f 0.36 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.76 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.95-3.74 (m, 2H), 3.66-3.55 (m, 2H), 3.50-3.40 (m, 2H), 3.34-3.24 (m, 4H), 2.62-2.47 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.30-2.11 (m, 2H), 1.90-1.45 (m, 9H), 1.38 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 1.00-0.90 (m, 9H)。

実施例 37 (70)

- 10 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.56 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

15 NMR (CD₃OD) : δ 7.40 (brs, 1H), 7.26 (dd, J = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.1

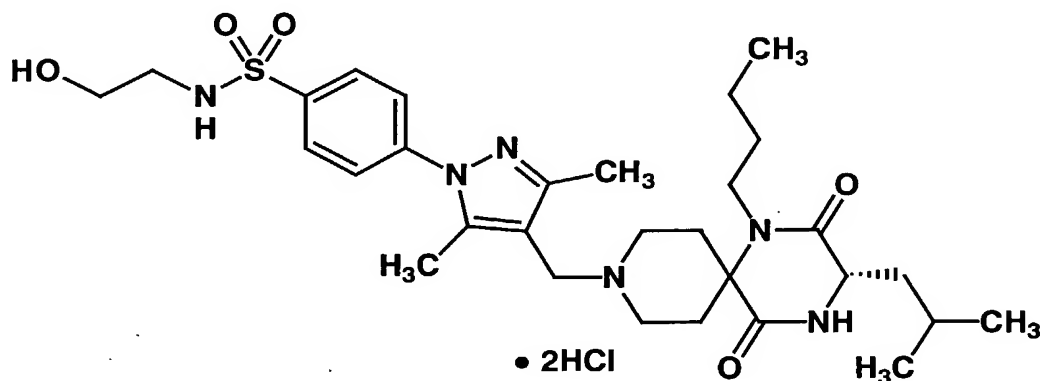
Hz, 1H), 4.59 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 4.26 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H),
3.84-3.66 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 4H), 3.24 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 2.49-2.35 (m, 2H),
2.25-2.08 (m, 2H), 1.89-1.43 (m, 5H), 1.36 (sextet, J = 7.2 Hz, 2H), 0.98-0.91 (m,
9H)。

5

実施例 37 (71)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (2 - ヒドロキシエチルアミノスルホ
ニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザス

10 ピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



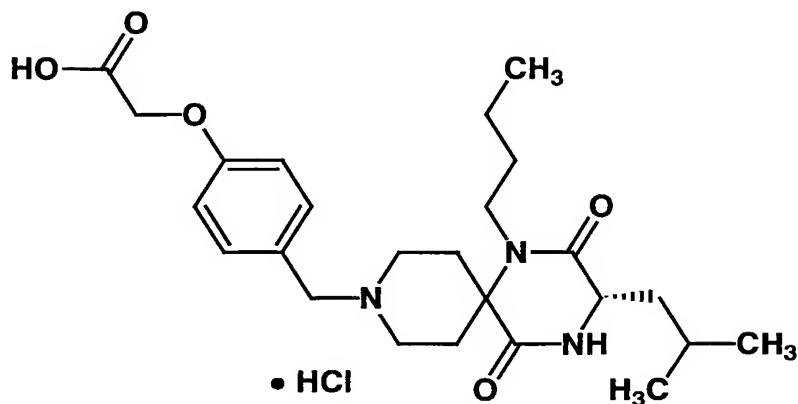
TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.03 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.72 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s,
2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.73 (m, 2H), 3.67-3.57 (m, 2H), 3.56 (t,
15 J = 5.7 Hz, 2H), 3.51-3.40 (m, 2H), 3.01 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 2.63-2.42 (m, 2H),
2.47 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.32-2.12 (m, 2H), 1.92-1.44 (m, 5H), 1.44-1.30 (m,
2H), 1.00-0.91 (m, 9H)。

実施例 37 (72)

20 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -

9 - (4 - (カルボキシメチルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

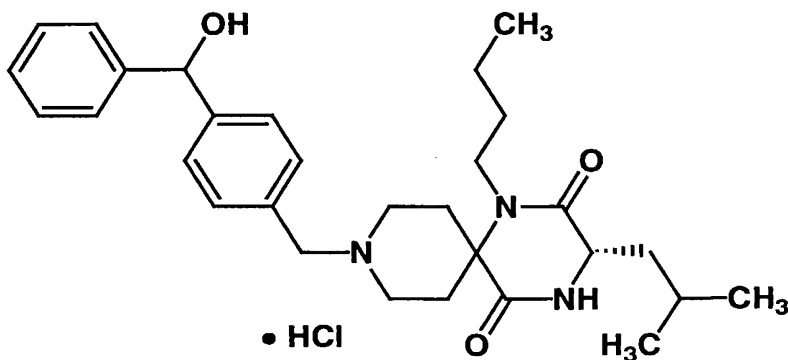


TLC : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.71 (s, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.67 (m, 2H), 3.53-3.33 (m, 4H), 2.46-2.28 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.90-1.27 (m, 7H), 0.99-0.90 (m, 9H)。

実施例 37 (73)

- 10 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (1 - フェニル - 1 - ヒドロキシメチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



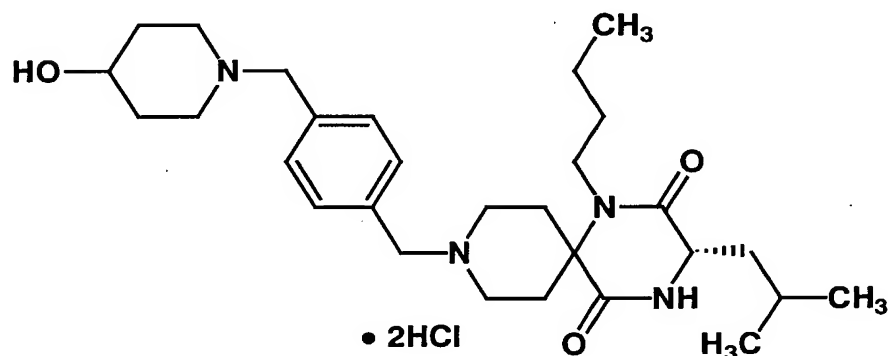
TLC : R_f 0.23 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.62-7.18 (m, 9H), 5.82 (s, 1H), 4.33 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.48-2.28 (m, 2H), 2.24-2.06 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H), 0.95 (t, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

5

実施例 37 (74)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



10

TLC : R_f 0.16 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

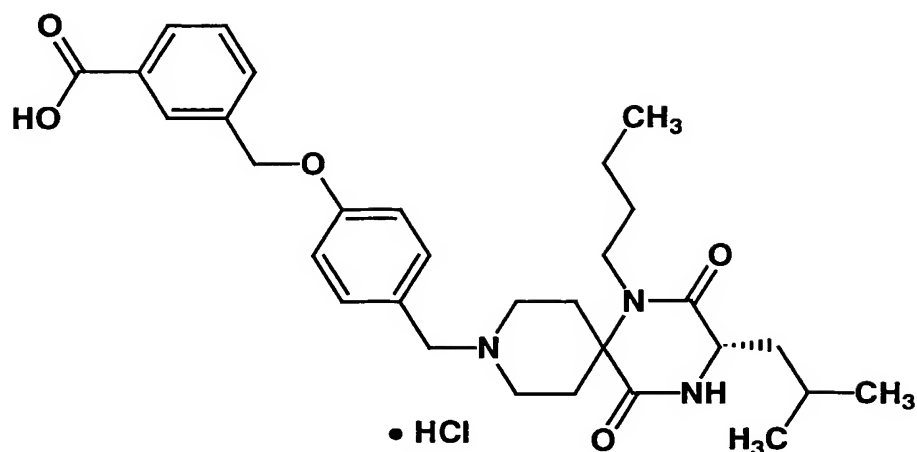
NMR (CD₃OD) : δ 7.73 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.69-7.61 (m, 2H), 4.42 (s, 2H), 4.40-4.34 (m, 2H), 4.11-4.05 (m, 1H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.72 (m, 2H), 3.55-3.38 (m, 4H), 3.16-3.00 (m, 1H), 2.60-2.38 (m, 2H), 2.26-2.06 (m, 3H), 2.00-1.88 (m, 2H), 1.88-1.43 (m, 9H), 1.43-1.14 (m, 2H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

15

実施例 37 (75)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(3-カルボキシフェニルメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

20



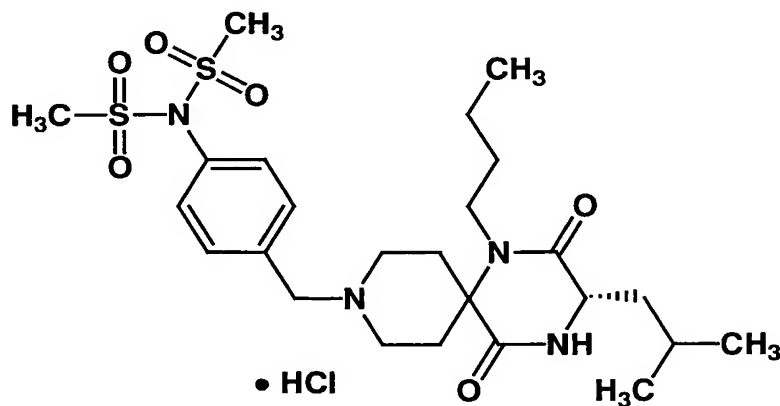
TLC : R_f 0.58 (クロロホルム：メタノール=5：1)；

NMR (CD₃OD) : δ 8.10 (s, 1H), 7.98 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.50 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 2H),

5 5.22 (s, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.68 (m, 2H), 3.54-3.32 (m, 4H), 2.42-2.08 (m, 4H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.95 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

实施例 37 (76)

10 (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (4 - (ビス (メチルスルホニル) アミノ) フェニルメチル) - 1, 4,
9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

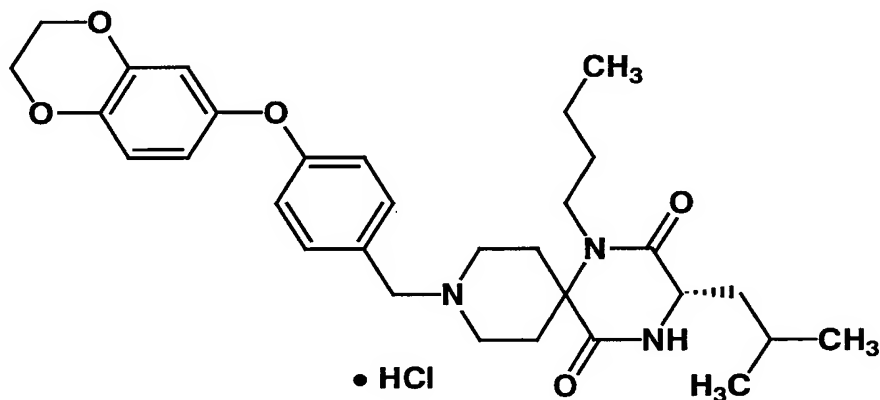


TLC : R_f 0.64 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.72 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.61 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.44 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.78 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 3.47 (s, 6H), 2.50-2.12 (m, 4H), 1.92-1.28 (m, 7H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (77)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (4 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルオキシ) フェニルメチル) -
10 - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



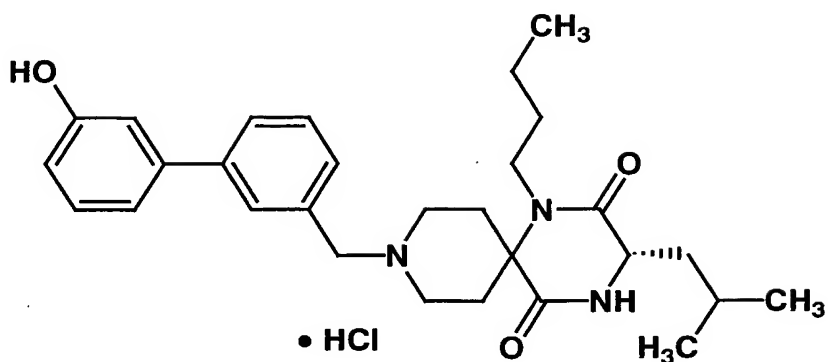
TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.49 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.85 (m, 1H), 6.55 - 6.51 (m, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.24 (s, 4H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H),
15 3.88-3.70 (m, 2H), 3.56-3.32 (m, 4H), 2.42-2.10 (m, 4H), 1.92-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (78)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
20 9 - (3 - (3 - ヒドロキシフェニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - ト

リアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.19 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.83 (s, 1H), 7.74 (m, 1H), 7.59-7.51 (m, 2H), 7.28 (m, 1H),

5 7.16-7.09 (m, 2H), 6.81 (m, 1H), 4.44 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H),

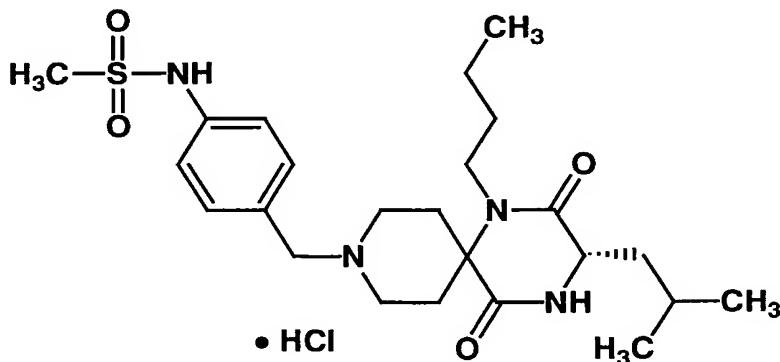
3.94-3.76 (m, 2H), 3.58-3.32 (m, 4H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H),

1.88-1.26 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J =

6.3 Hz, 3H)。

10 実施例 37 (79)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) -
9 - (4 - (メチルスルホニルアミノ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - ト
リアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



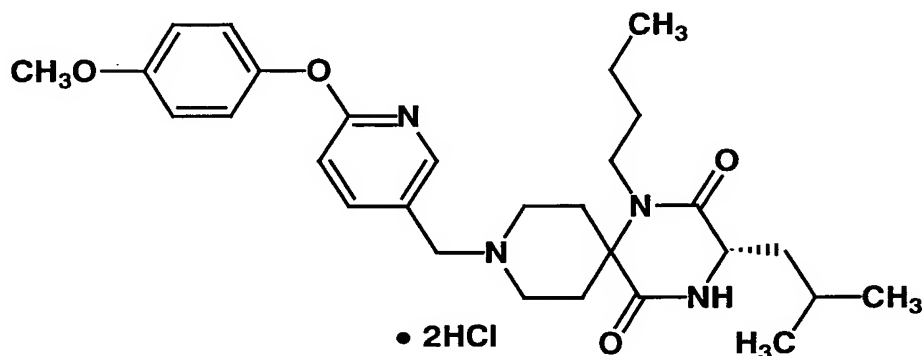
15 TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.34 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 2H), 3.52-3.14 (m, 4H), 3.01 (s, 3H), 2.46-2.30 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.88-1.10 (m, 7H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

5

実施例 37 (80)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - (4 - メトキシフェニルオキシ) ピリジン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



10

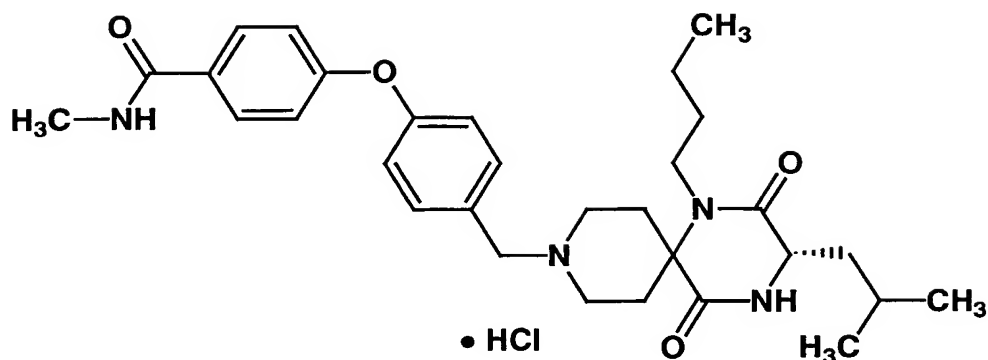
TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.30 (m, 1H), 8.05 (m, 1H), 7.10-6.86 (m, 5H), 4.39 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.74 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.54-3.32 (m, 4H), 2.54-2.32 (m, 2H), 2.28-2.05 (m, 2H), 1.88-1.26 (m, 7H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

15

実施例 37 (81)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルアミノカルボニルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

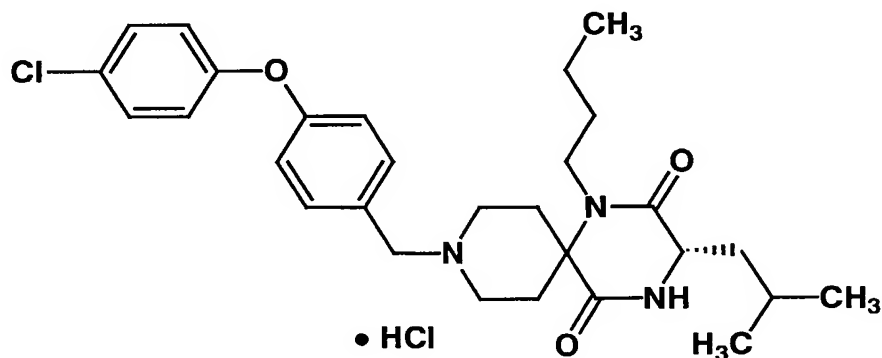


TLC : Rf 0.54 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.39 (brd, J = 4.5 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.35 (s, 2H),
 5 4.01 (m, 1H), 3.86-3.73 (m, 2H), 3.53-3.41 (m, 4H), 2.91 (d, J = 4.5 Hz, 3H),
 2.55-2.30 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.90-1.30 (m, 7H), 0.95 (t, J = 6.9 Hz, 3H),
 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 37 (82)

10 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-クロロフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



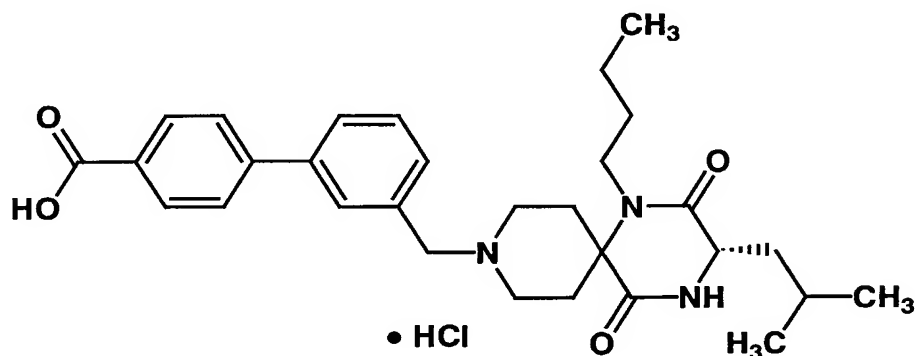
TLC : Rf 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

15 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.08 (d, J

= 8.4 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.01 (m, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.60-3.30 (m, 4H), 2.50-2.10 (m, 4H), 1.90-1.30 (m, 7H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5 実施例 37 (83)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - (4 - カルボキシフェニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

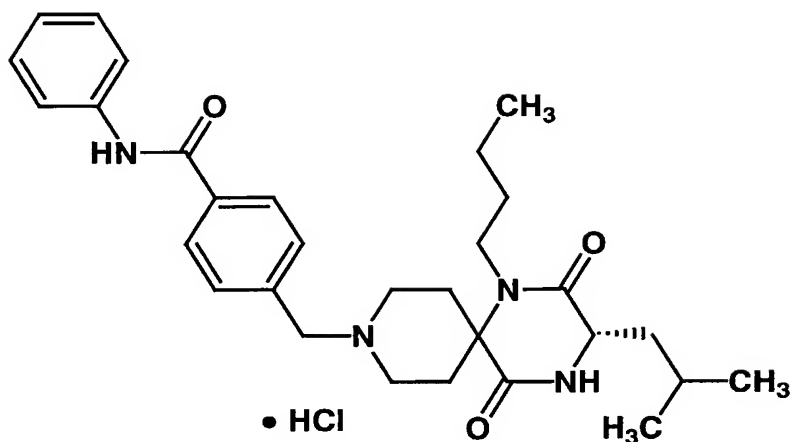


- 10 TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.13 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.84 (m, 1H), 7.81 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.66-7.56 (m, 2H), 4.46 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.96-3.74 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.48-2.08 (m, 4H), 1.88-1.24 (m, 7H), 0.95 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

15

実施例 37 (84)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (フェニルアミノカルボニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

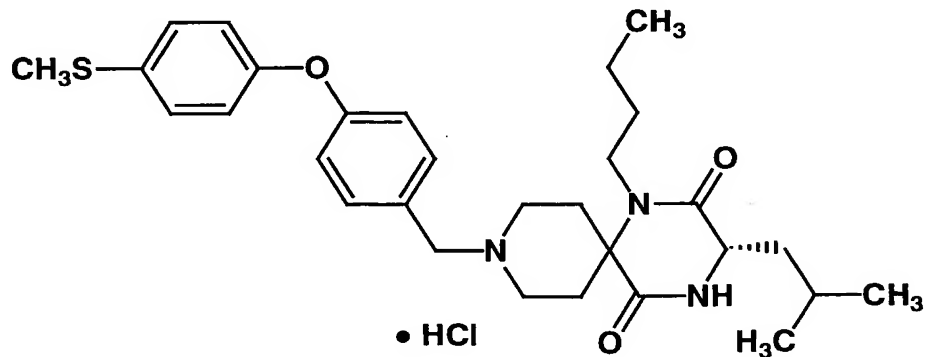


TLC : R_f 0.27 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.07 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.74 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.72-7.67 (m, 2H), 7.38 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 4.47 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.76 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.54-2.36 (m, 2H), 2.28-2.12 (m, 2H), 1.90-1.24 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (85)

- 10 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルチオフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

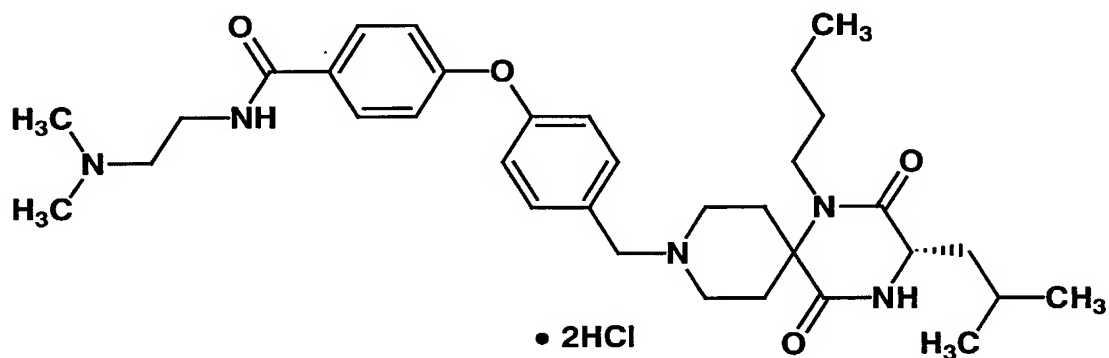


TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.33 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.68 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.48 (s, 3H), 2.48-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.90-1.28 (m, 7H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 37 (86)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - (2 - ジメチルアミノエチルアミノカルボニル) フェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

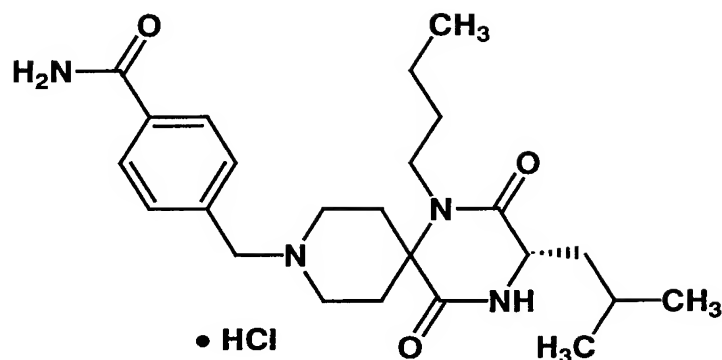


TLC : R_f 0.11 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 7.93 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.64 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.10 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.70 (m, 4H), 3.54-3.36 (m, 6H), 2.98 (s, 6H), 2.62-2.44 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.88-1.30 (m, 7H), 0.98-0.90 (m, 9H)。

実施例 37 (87)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - アミノカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ

ロ [5 . 5] ウンデカン・塩酸塩

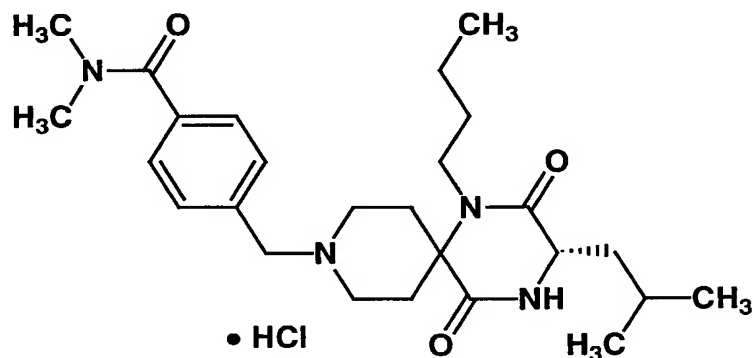


TLC : R_f 0.17 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.98 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.70 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.74 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 4H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.88-1.28 (m, 7H), 0.98-0.88 (m, 9H)。

実施例 37 (88)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ジメチルアミノカルボニルフェニルメチル))-1,4,9-トリ
 10 アザスピロ [5 . 5] ウンデカン・塩酸塩



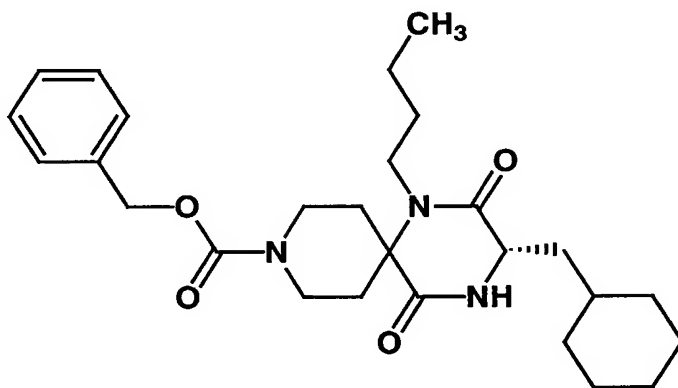
TLC : R_f 0.31 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.68 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.82 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 4H), 3.11 (s, 15 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.88-1.28 (m, 7H), 0.98-0.88 (m, 9H)。

3H), 2.99 (s, 3H), 2.56-2.38 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.86-1.28 (m, 7H), 1.00-0.86 (m, 9H)。

実施例 3 8

- 5 (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - ベンジルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



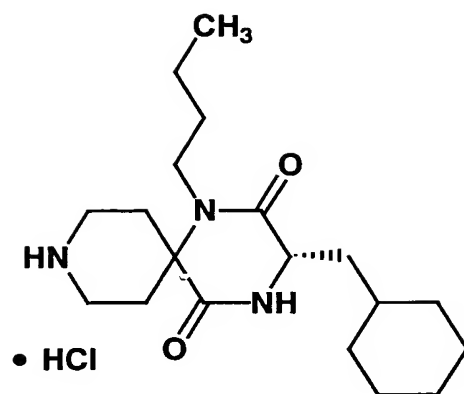
- 10 N - (t - ブチルオキシカルボニル) - L - ロイシンの代わりに、N - (t - ブチルオキシカルボニル) - L - シクロヘキシルアラニンを用いて、実施例 3 5 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.35 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

- 15 NMR (CDCl₃) : δ 7.39-7.31 (m, 5H), 6.48 (brs, 1H), 5.16 (s, 2H), 4.15 (brs, 2H), 4.00 (ddd, J = 9.6, 4.8, 1.5 Hz, 1H), 3.76-3.16 (m, 4H), 2.02-1.12 (m, 19H), 1.08-0.88 (m, 2H), 0.92 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 3 9

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



実施例 38 で製造した化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.08 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 90 : 10 : 1) ;

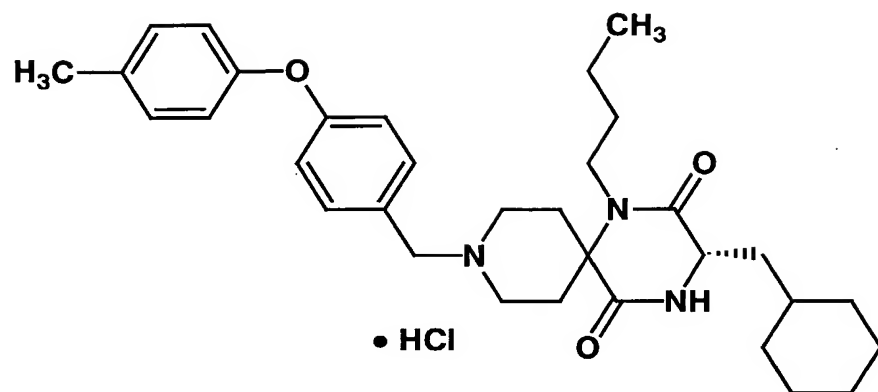
- 5 NMR (CD₃OD) : δ 4.05 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.46-3.34 (m, 4H), 2.40-2.04 (m, 4H), 1.83-1.46 (m, 10H), 1.39 (sextet, J = 7.5 Hz, 2H), 1.33 - 1.15 (m, 3H), 1.05-0.86 (m, 2H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (1) ~ 40 (90)

- 10 実施例 39 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 40 (1)

- 15 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

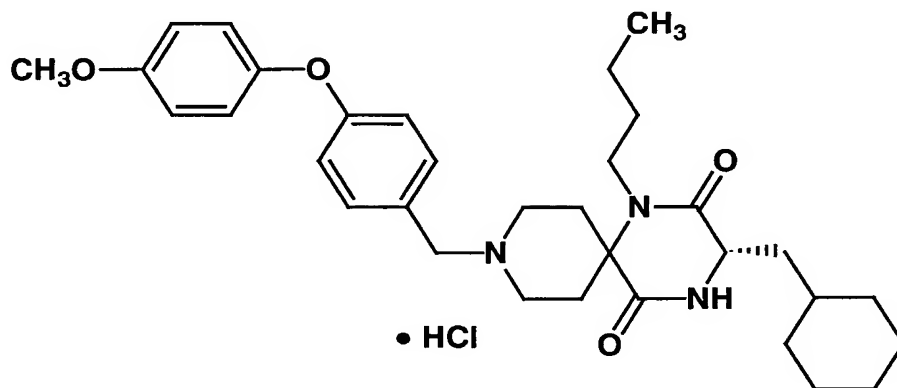


TLC : R_f 0.71 (酢酸エチル) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.19 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H),
 5 3.87-3.69 (m, 2H), 3.55-3.42 (m, 2H), 3.42-3.34 (m, 2H), 2.49-2.30 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.05-0.85 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (2)

- 10 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(4-メトキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



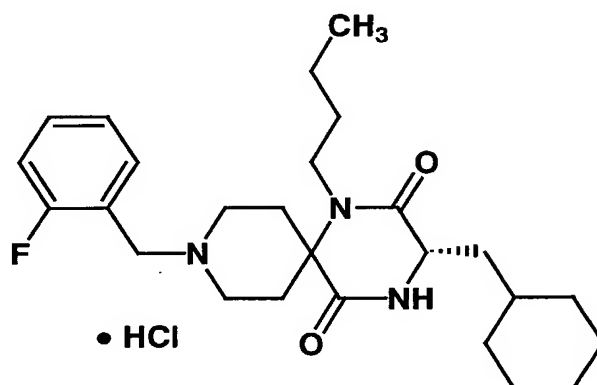
TLC : R_f 0.67 (酢酸エチル) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.49 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.02-6.92 (m, 6H), 4.31 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.69 (m, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.54-3.30 (m, 4H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.83-1.10 (m, 15H), 1.05-0.83 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5

実施例 40 (3)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : R_f 0.38 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

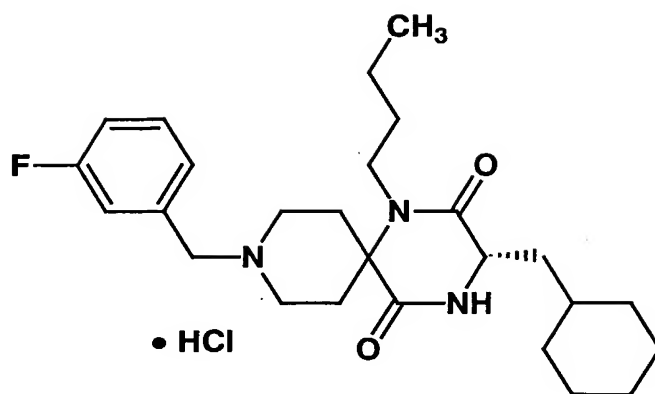
NMR (CD₃OD) : δ 7.70-7.53 (m, 2H), 7.38-7.23 (m, 2H), 4.44 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.77 (m, 2H), 3.60-3.45 (m, 2H), 3.45-3.30 (m, 2H), 2.53-2.34 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.83-1.10 (m, 15H), 1.05-0.82 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

15

実施例 40 (4)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

20

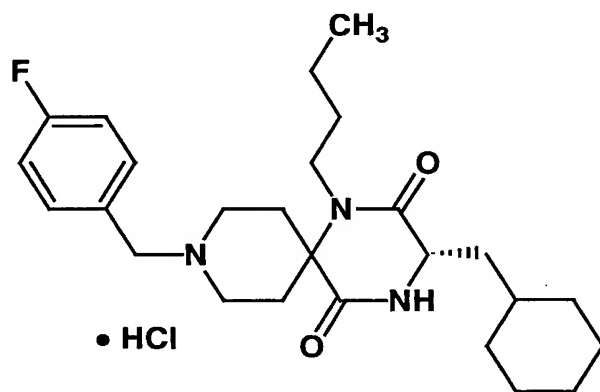


TLC : R_f 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57-7.48 (m, 1H), 7.44-7.37 (m, 2H), 7.30-7.21 (m, 1H),
 4.38 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.55-3.33 (m, 4H),
 5 2.56-2.37 (m, 2H), 2.25-2.04 (m, 2H), 1.82-1.08 (m, 15H), 1.06-0.83 (m, 2H),
 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (5)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9
 10 - (4 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン・塩酸塩



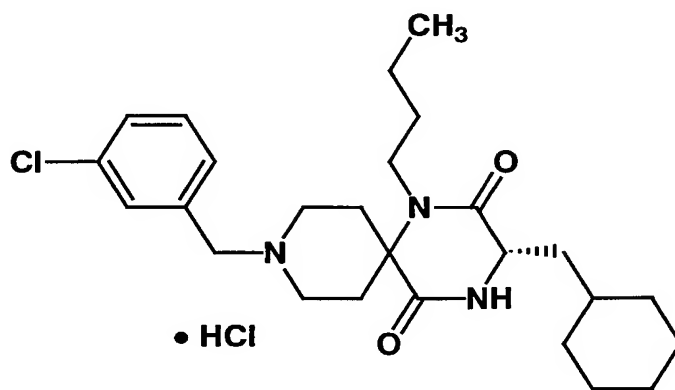
TLC : R_f 0.27 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.62 (dd, J = 8.7, 5.1 Hz, 2H), 7.23 (dd, J = 8.7, 8.7 Hz, 2H),

4.36 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.71 (m, 2H), 3.53-3.33 (m, 4H), 2.53-2.35 (m, 2H), 2.27-2.04 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.05-0.82 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5 実施例 40 (6)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

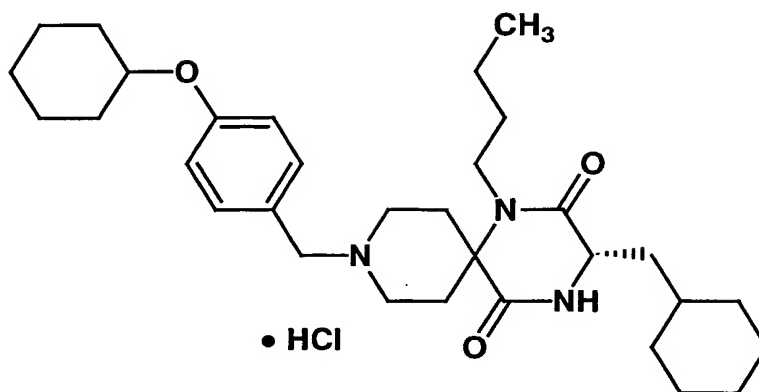


- 10 TLC : R_f 0.60 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.65 (m, 1H), 7.55-7.49 (m, 3H), 4.37 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.0, 4.5 Hz, 1H), 3.83 (m, 2H), 3.54-3.47 (m, 2H), 3.41-3.35 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 2.18 (m, 2H), 1.78-1.47 (m, 9H), 1.42-1.17 (m, 6H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.97-0.92 (m, 2H)。

15

実施例 40 (7)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - シクロヘキシルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

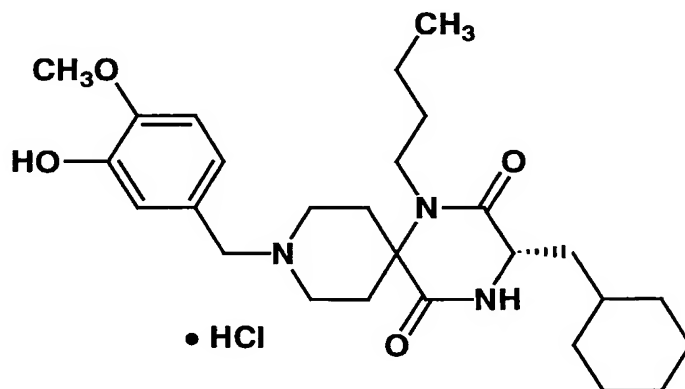


TLC : R_f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.41 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.36 (m, 1H), 4.24 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.82-3.65 (m, 2H), 3.50-3.30 (m, 4H), 2.42-2.25 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 2.02-1.92 (m, 2H), 1.84-1.14 (m, 23H), 1.04-0.89 (m, 5H)。

実施例 40 (8)

(3S)-1-(4-(4-メトキシ-3-ヒドロキシフェニル)ベンジル)ピペリジン-4,4-ジメチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-1H-イミダゾール-5-シクロヘキシルメチル・塩酸塩



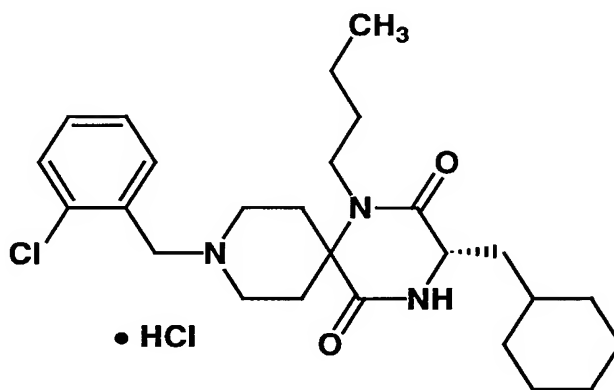
TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.01 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.99-6.93 (m, 2H), 4.22 (s, 2H),

4.03 (dd, $J = 7.5, 4.8$ Hz, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.83-3.67 (m, 2H), 3.52-3.42 (m, 2H), 3.42-3.33 (m, 2H), 2.44-2.27 (m, 2H), 2.26-2.07 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.04-0.89 (m, 5H)。

5 実施例 40 (9)

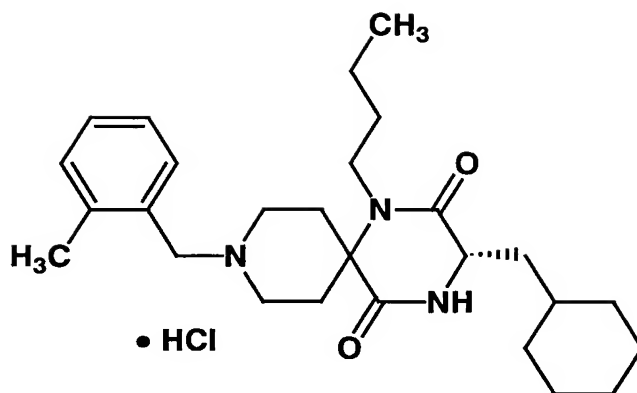
(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



- 10 TLC : R_f 0.77 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.69 (dd, $J = 7.5, 2.1$ Hz, 1H), 7.60 (dd, $J = 7.5, 2.1$ Hz, 1H), 7.51 (dt, $J = 2.1, 7.5$ Hz, 1H), 7.47 (dt, $J = 2.1, 7.5$ Hz, 1H), 4.52 (s, 2H), 4.04 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 4.00-3.82 (m, 2H), 3.60-3.48 (m, 2H), 3.43-3.34 (m, 2H), 2.48-2.29 (m, 2H), 2.28-2.07 (m, 2H), 1.83-1.44 (m, 10H), 1.43-1.12 (m, 5H),
 15 1.04-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (10)

- (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩
- 20

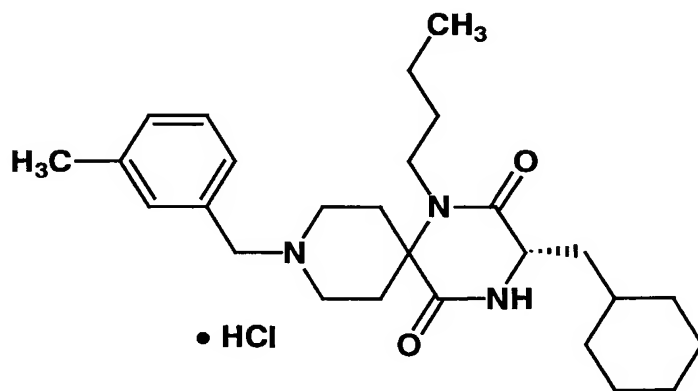


TLC : R_f 0.77 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.56 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.41-7.30 (m, 3H), 4.41 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.79 (m, 2H), 3.57-3.48 (m, 2H), 3.44-3.39 (m, 2H), 2.56-2.38 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.26-2.06 (m, 2H), 1.82-1.15 (m, 15H), 1.02-0.84 (m, 5H)。

实施例 40 (1 1)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9
10 - (3-メチルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]
ウンデカン・塩酸塩



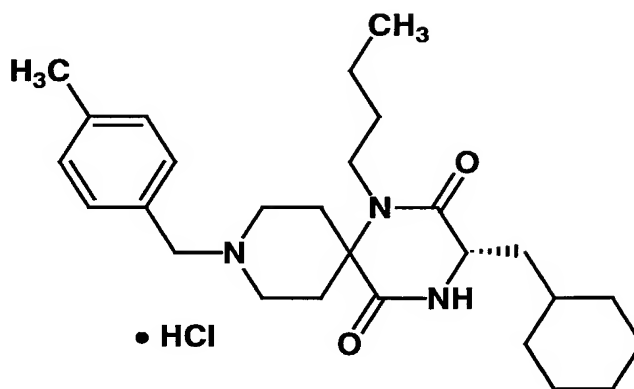
TLC : R_f 0.58 (クロロホルム：メタノール=10：1)；

NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.28 (m, 4H), 4.31 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz,

1H), 3.84-3.70 (m, 2H), 3.52-3.46 (m, 4H), 2.51-2.30 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.24-2.04 (m, 2H), 1.80-1.12 (m, 15H), 1.02-0.84 (m, 5H)。

実施例 40 (12)

- 5 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

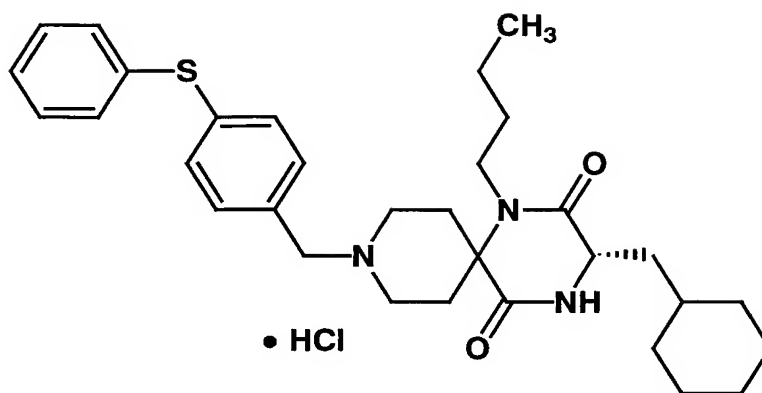


TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.44 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.31 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.70 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 4H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.81-1.10 (m, 15H), 1.04-0.82 (m, 5H)。

15 実施例 40 (13)

- (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - フェニルチオフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

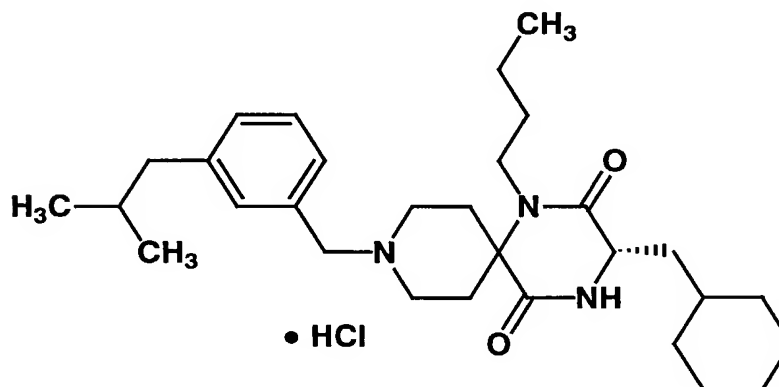


TLC : R_f 0.74 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50-7.37 (m, 7H), 7.29 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H),
 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.70 (m, 2H), 3.50-3.32 (m, 4H), 2.56-2.38 (m,
 5 2H), 2.24-2.05 (m, 2H), 1.81-1.06 (m, 15H), 1.02-0.84 (m, 5H)。

実施例 40 (14)

(3S)-1-(4-(2-methylpropyl)phenyl)-2,5-dioxo-3-cyclohexylmethyl-9-(3-(2-methylpropyl)phenylmethyl)-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecan-11-yl hydrogen chloride
 10



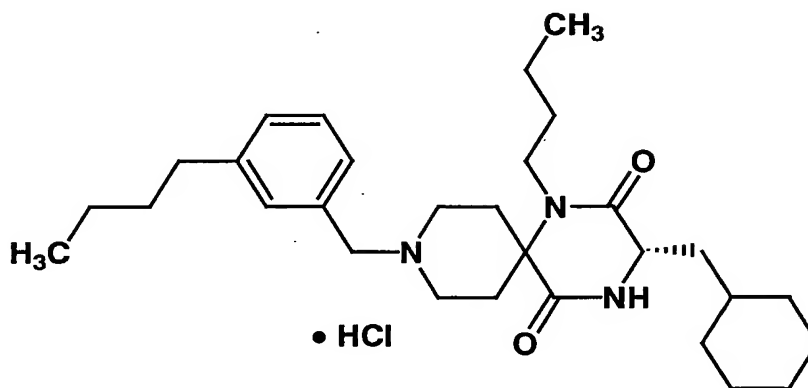
TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 4.32 (s,
 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.52 (d, J =

7.2 Hz, 2H), 2.45 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 1.96-1.14 (m, 16H), 0.97-0.89 (m, 11H)。

実施例 40 (15)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9
5 - (3 - ブチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン・塩酸塩

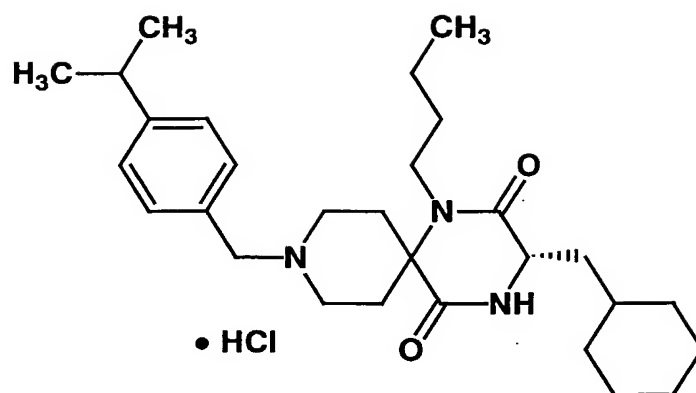


TLC : R_f 0.37 (クロロホルム : メタノール = 19 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.32 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.31 (s,
10 2H), 4.03 (dd, J = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 3.79 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.66 (t, J =
7.5 Hz, 2H), 2.41 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 1.82-1.20 (m, 19H), 1.00-0.89 (m, 2H),
0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (16)

15 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9
- (4 - イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン・塩酸塩

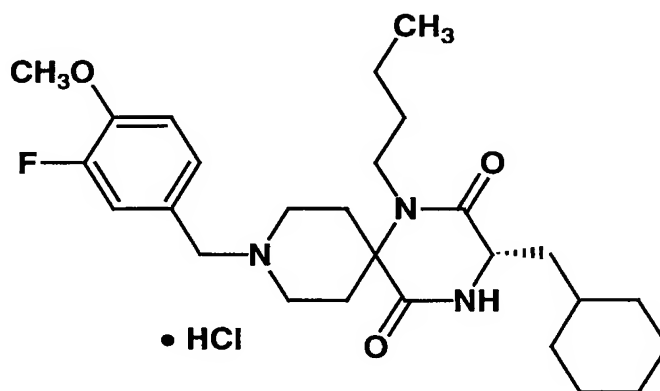


TLC : R f 0.63 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.37 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.74 (m, 2H), 3.52-3.43 (m, 2H), 3.43-3.32 (m, 2H), 3.02-2.90 (m, 1H), 2.45-2.25 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.80-1.12 (m, 21H), 1.04-0.88 (m, 5H)。

实施例 40 (17)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9
 10 - (4-メトキシ-3-フルオロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザ
 スピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



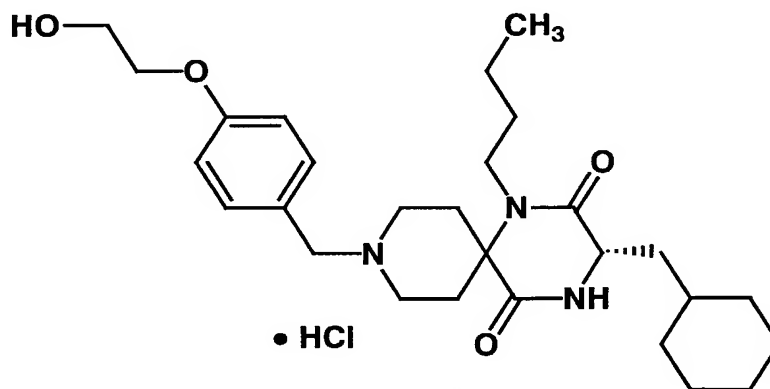
TLC : R f 0.58 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.31 (m, 2H), 7.22-7.17 (m, 1H), 4.30 (s, 2H), 4.03 (dd,

$J = 7.8, 4.8 \text{ Hz}$, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.86-3.70 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 4H), 2.52-2.32 (m, 2H), 2.26-2.05 (m, 2H), 1.80-1.15 (m, 15H), 1.01-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (18)

- 5 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (2 - ヒドロキシエトキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

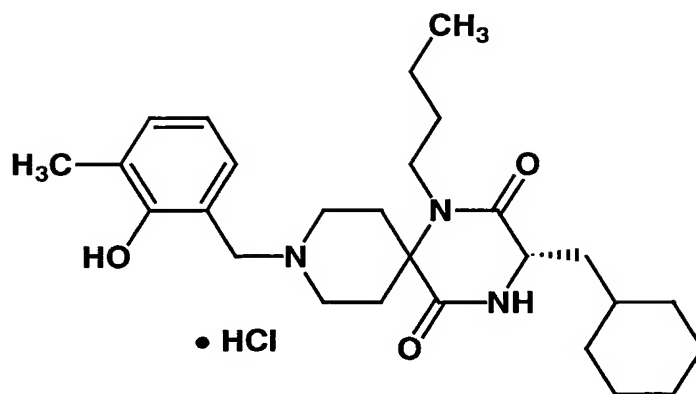


TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, $J = 8.7 \text{ Hz}$, 2H), 7.06 (d, $J = 8.7 \text{ Hz}$, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.08-4.00 (m, 3H), 3.89-3.84 (m, 2H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 4H), 2.48-2.30 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (19)

- 15 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2 - ヒドロキシ - 3 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

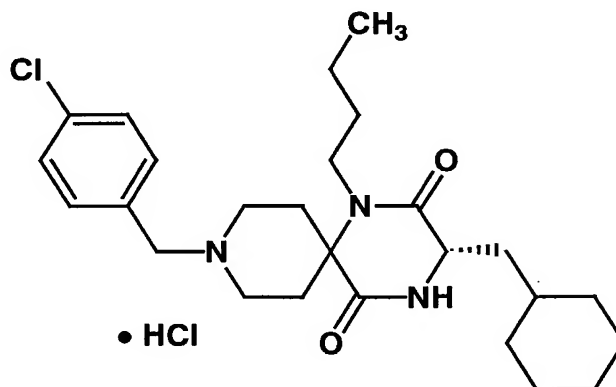


TLC : R_f 0.85 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.30-7.21 (m, 2H), 6.88 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.2 Hz, 1H), 3.94-3.78 (m, 2H), 3.56-3.46 (m, 2H), 3.42-3.32 (m, 2H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.82-1.01 (m, 15H), 1.00-0.87 (m, 5H)。

実施例 40 (20)

(3S)-1-(4-(4-chlorophenyl)methyl)piperidin-4-yl-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecan-11-yl methylcyclohexylcarbamate hydrochloride



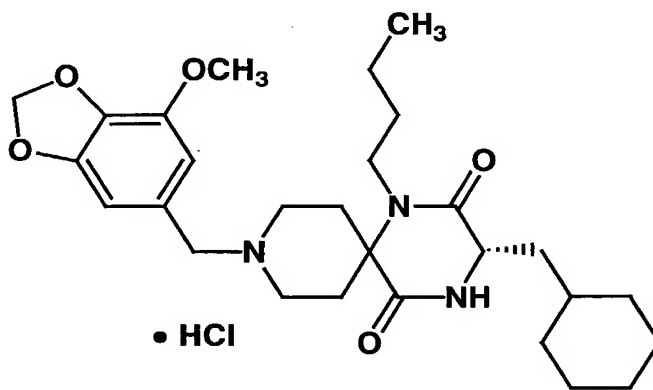
TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.57 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.36 (s,

2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.8$ Hz, 1H), 3.89-3.71 (m, 2H), 3.53-3.33 (m, 4H), 2.52-2.32 (m, 2H), 2.26-2.07 (m, 2H), 1.83-1.06 (m, 15H), 1.04-0.84 (m, 2H), 0.95 (t, $J = 6.9$ Hz, 3H)。

5 実施例 40 (21)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(7-メトキシ-1,3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

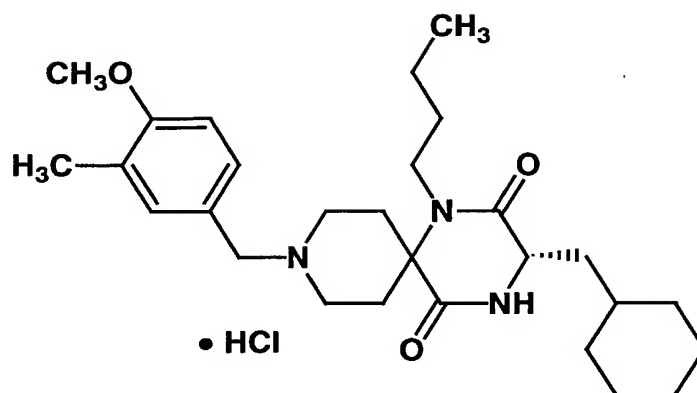


- 10 TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 6.85 (s, 1H), 6.74 (s, 1H), 5.99 (s, 2H), 4.25 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.87-3.67 (m, 2H), 3.54-3.34 (m, 4H), 2.53-2.30 (m, 2H), 2.25-2.05 (m, 2H), 1.83-1.10 (m, 15H), 1.06-0.83 (m, 2H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

15

実施例 40 (22)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3-メチル-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

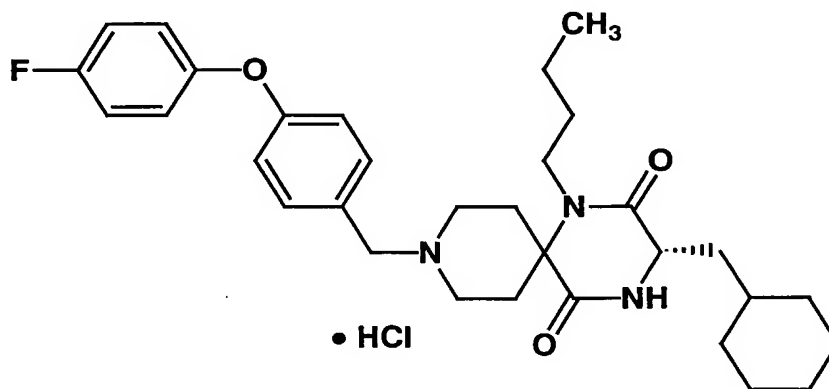


TLC : R f 0.38 (クロロホルム：メタノール=20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.37-7.28 (m, 2H), 6.99 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.25 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.84-3.66 (m, 2H), 3.52-3.32 (m, 4H), 2.48-2.28 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.22-2.05 (m, 2H), 1.83-1.10 (m, 15H), 1.06-0.83 (m, 2H), 0.94 (t, J = 6.9 Hz, 3H)。

实施例 40 (23)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-
10 - (4-(4-フルオロフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-
トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



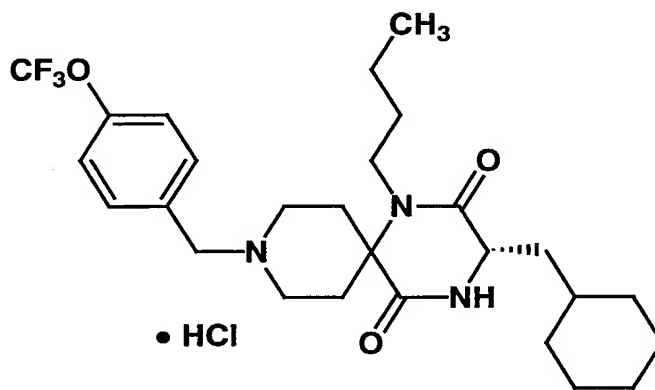
TLC : R_f 0.53 (クロロホルム：メタノール=20：1)；

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.18-7.00 (m, 6H), 4.33 (s, 2H),

4.04 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.87-3.69 (m, 2H), 3.55-3.32 (m, 4H), 2.52-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.06-0.83 (m, 2H), 0.95 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H)。

5 実施例 40 (24)

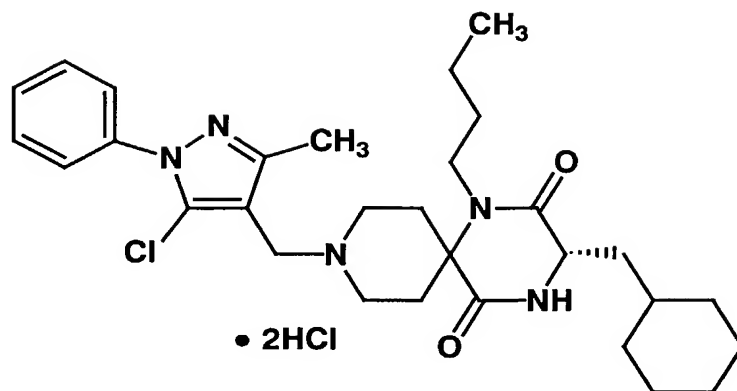
(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - トリフルオロメトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



- 10 TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.72-7.69 (m, 2H), 7.41 (d, $J = 7.8$ Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.03 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.90-3.75 (m, 2H), 3.52-3.38 (m, 4H), 2.54-2.32 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

15 実施例 40 (25)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3 - メチル - 5 - クロロ - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



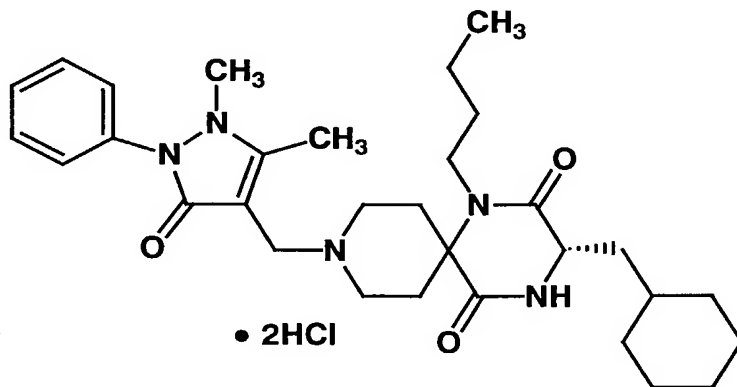
TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.56-7.50 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.98-3.80 (m, 2H), 3.70-3.59 (m, 2H), 3.50-3.40 (m, 2H), 2.60-2.38 (m, 2H),

5 2.45 (s, 3H), 2.32-2.14 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 1.02-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (26)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 -
 - (2, 3 - ジメチル - 5 - オキソ - 1 - フェニルピラゾリン - 4 - イルメ
 10 チル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



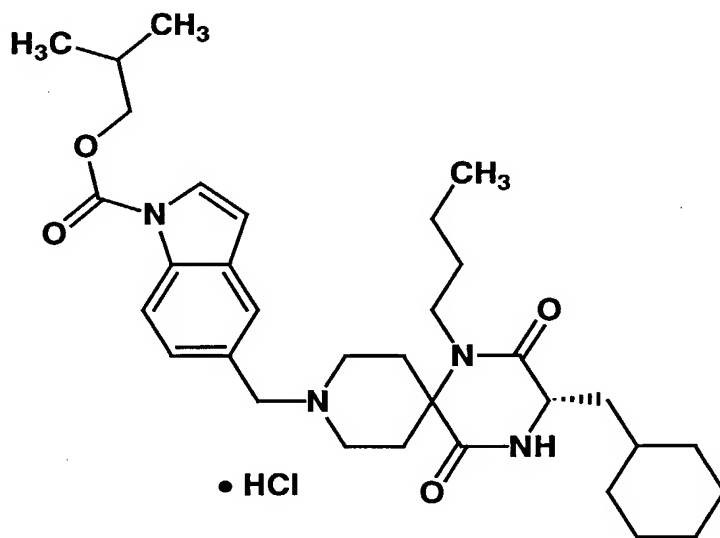
TLC : R_f 0.27 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.62-7.48 (m, 3H), 7.44-7.38 (m, 2H), 4.13 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 2H), 3.64-3.52 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 2H),

3.35 (s, 3H), 2.60-2.40 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.84 (m, 5H)。

実施例 40 (27)

- 5 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (1 - (2 - メチルプロピルオキシカルボニル) インドール - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

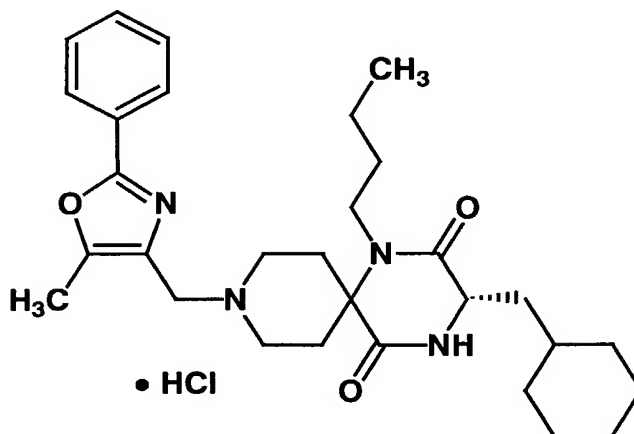
- 10 NMR (CD₃OD) : δ 8.26 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.76 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 6.74 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.44 (s, 2H), 4.25 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.72 (m, 2H), 3.52-3.40 (m, 4H), 2.52-2.36 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 3H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.07 (d, J = 9.0 Hz, 6H), 1.00-0.84 (m, 5H)。

15

実施例 40 (28)

- (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (5 - メチル - 2 - フェニルオキサゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4,

9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



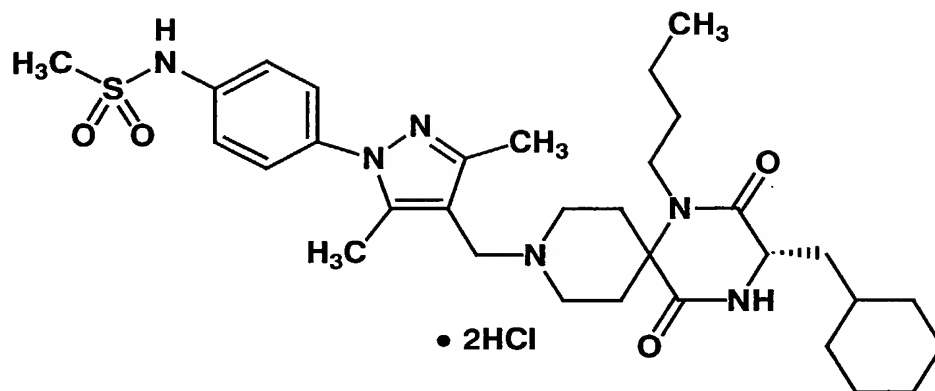
TLC : Rf 0.48 (クロロホルム：メタノール=10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.04-8.00 (m, 2H), 7.51-7.49 (m, 3H), 4.34 (s, 2H), 4.04 (dd,

5 J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.98-3.82 (m, 2H), 3.70-3.60 (m, 2H), 3.44-3.38 (m, 2H),
2.52 (s, 3H), 2.50-2.36 (m, 2H), 2.28-2.12 (m, 2H), 1.80-1.12 (m, 15H), 1.00-0.86
(m, 5H)。

实施例 40 (29)

10 (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3,5-ジメチル-1-(4-メチルスルホニルアミノフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

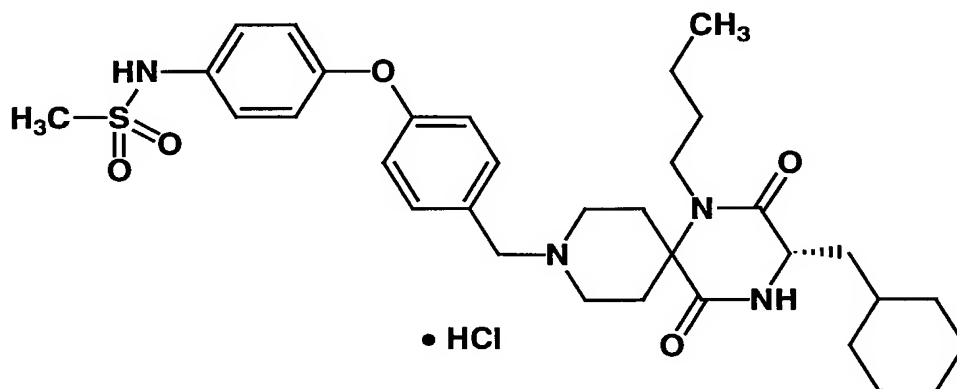


TLC : Rf 0.32 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.41 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.76 (m, 2H), 3.65-3.58 (m, 2H), 3.52-3.45 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 2.64-2.50 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.28-2.12 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.00-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (30)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



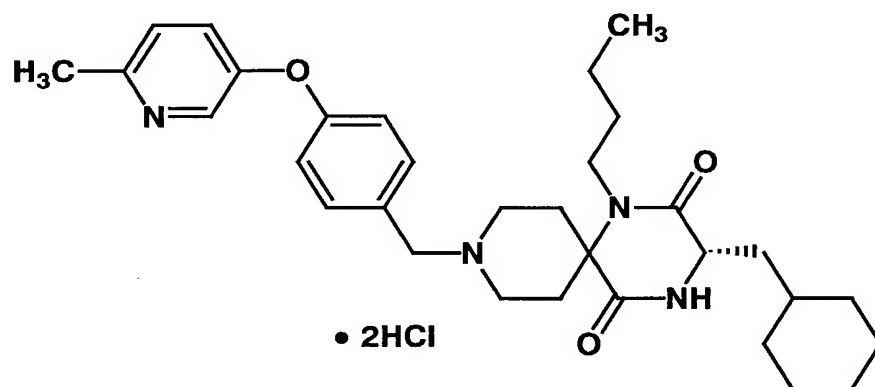
TLC : Rf 0.42 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.08-7.00

(m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.85-3.72 (m, 2H), 3.54-3.36 (m, 4H), 2.95 (s, 3H), 2.48-2.34 (m, 2H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.80-1.14 (m, 15H), 0.98-0.88 (m, 5H)。

5 実施例 40 (31)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

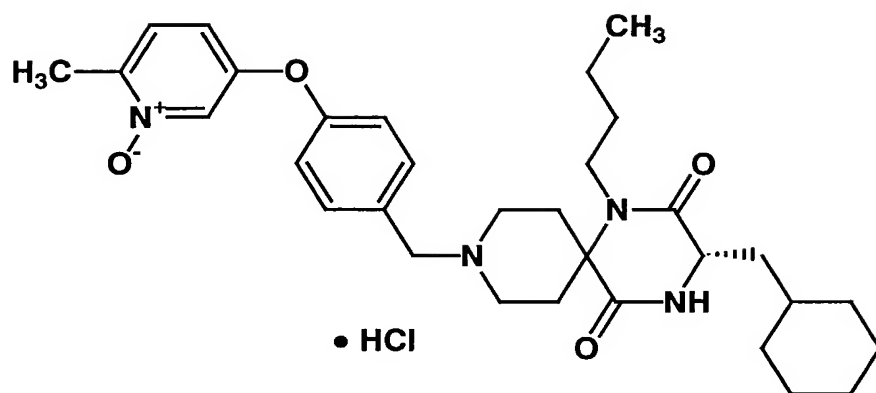


- 10 TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.58 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.17 (m, 1H), 7.90 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 2H), 3.56-3.44 (m, 4H), 2.76 (s, 3H), 2.68-2.50 (m, 2H), 2.24-2.06 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

15

実施例 40 (32)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 1 - オキシド - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

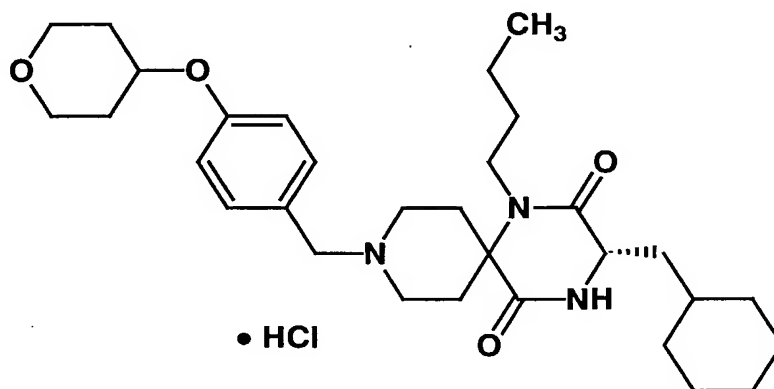


TLC : Rf 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD): δ 8.40 (m, 1H), 7.69 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.69 (m, 1H), 7.54 (m, 1H), 7.27 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 2H), 3.58-3.39 (m, 4H), 2.59 (s, 3 H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.84 (m, 5H)。

实施例 40 (33)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9
10 - (4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1,
4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



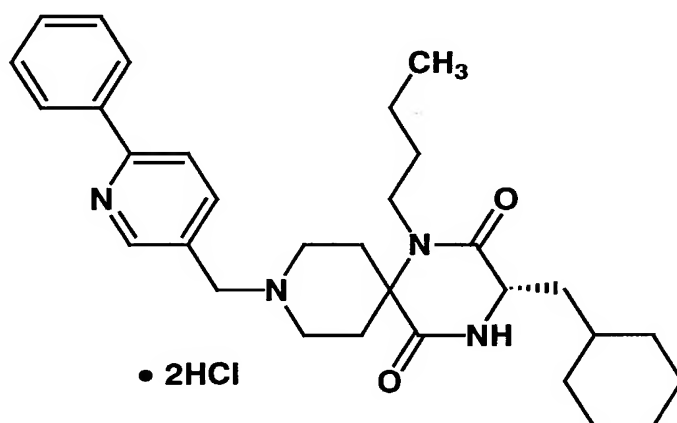
TLC : R f 0.48 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.49 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.05 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.63 (m,

1H), 4.27 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.97-3.90 (m, 2H), 3.84-3.66 (m, 2H), 3.62-3.52 (m, 2H), 3.50-3.38 (m, 3H), 2.54-2.38 (m, 2H), 2.22-1.98 (m, 4H), 1.80-1.10 (m, 18H), 1.00-0.86 (m, 5H)。

5 実施例 40 (34)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (6 - フェニルピリジン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

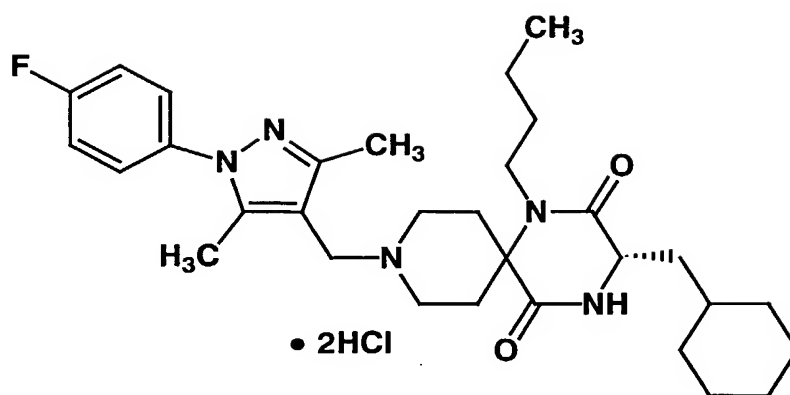


- 10 TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 9.14 (m, 1H), 8.75 (m, 1H), 8.36 (m, 1H), 8.02-7.99 (m, 2H), 7.68-7.62 (m, 3H), 4.63 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 4.02-3.94 (m, 2H), 3.64-3.42 (m, 4H), 2.72-2.56 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.00-0.86 (m, 5H)。

15

実施例 40 (35)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

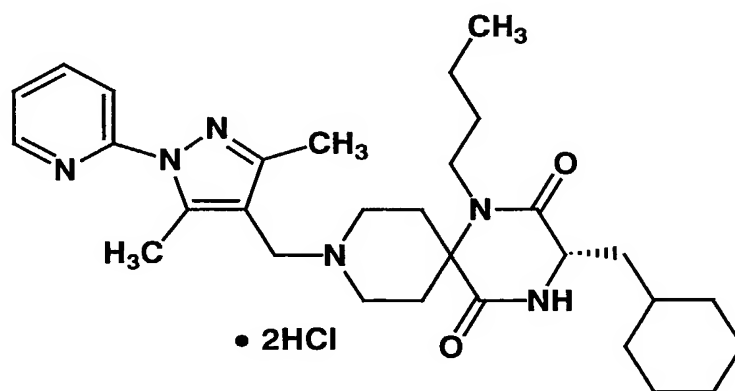


TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.58-7.50 (m, 2H), 7.37-7.28 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.73 (m, 2H), 3.67-3.55 (m, 2H), 3.53-3.42 (m, 2H),
 5 2.70-2.48 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.84-1.10 (m, 15H), 1.08-0.93 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (36)

(3S)-1-butyl-2,5-dimethyl-3-(pyridin-2-yl)-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecan-2-one dihydrochloride
 10 - (3,5-dimethyl-1-(pyridin-2-yl)pyrazol-4-ylmethyl)-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecan-2-one dihydrochloride



TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.53 (dd, J = 4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.11-8.00 (m, 1H), 7.84 (d, J

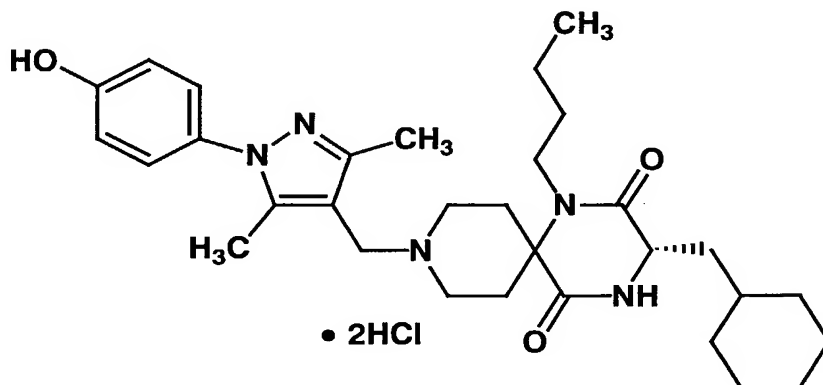
= 8.4 Hz, 1H), 7.49-7.41 (m, 1H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.95-3.74 (m, 2H), 3.66-3.54 (m, 2H), 3.50-3.37 (m, 2H), 2.68 (s, 3H), 2.64-2.40 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.93-1.10 (m, 15H), 1.08-0.92 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5

実施例 40 (37)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - ヒドロキシフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩酸

10 塩



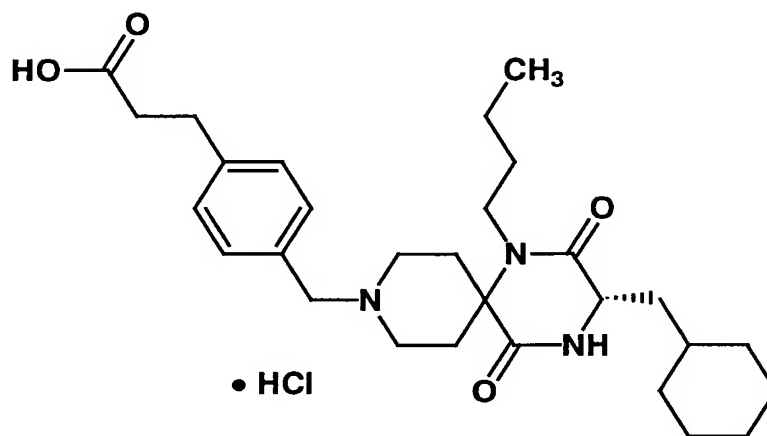
TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.34 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.96 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.35 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.78 (m, 2H), 3.64-3.61 (m, 2H), 3.50 (t, J = 8.0 Hz, 2H), 2.68-2.56 (m, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.25-2.12 (m, 2H), 1.81-1.19 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.99-0.91 (m, 2H)。

実施例 40 (38)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9

－（４－（２－カルボキシエチル）フェニルメチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン・塩酸塩

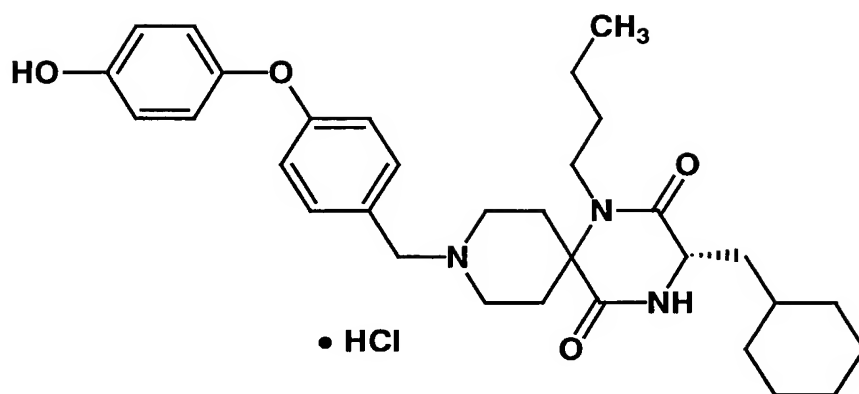


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.85-3.74 (m, 2H), 3.50-3.46 (m, 2H), 3.40-3.35 (m, 2H), 2.96 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.62 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.42-2.30 (m, 2H), 2.34-2.10 (m, 2H), 1.78-1.18 (m, 15H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.94 (m, 2H)。

10 実施例 40 (39)

(3S)－１－ブチル－２，５－ジオキソ－３－シクロヘキシルメチル－９－（４－（４－ヒドロキシフェニルオキシ）フェニルメチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン・塩酸塩

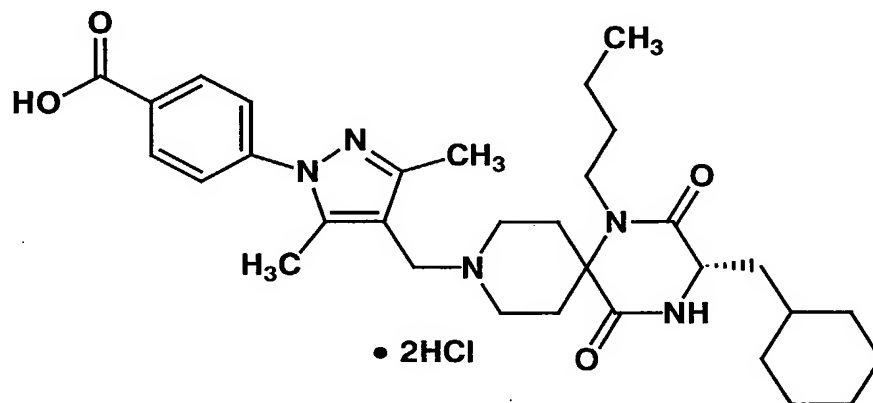


TLC : Rf 0.54 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.97 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.88 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.80 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.30 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.83-3.72 (m, 2H), 3.49-3.34 (m, 4H), 2.38 (m, 2H), 2.23-2.10 (m, 2H), 1.78-1.16 (m, 15H), 1.02-0.92 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

实施例 40 (40)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-
10 - (3,5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピラゾール-4-
イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸
塩



TLC : Rf 0.25 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

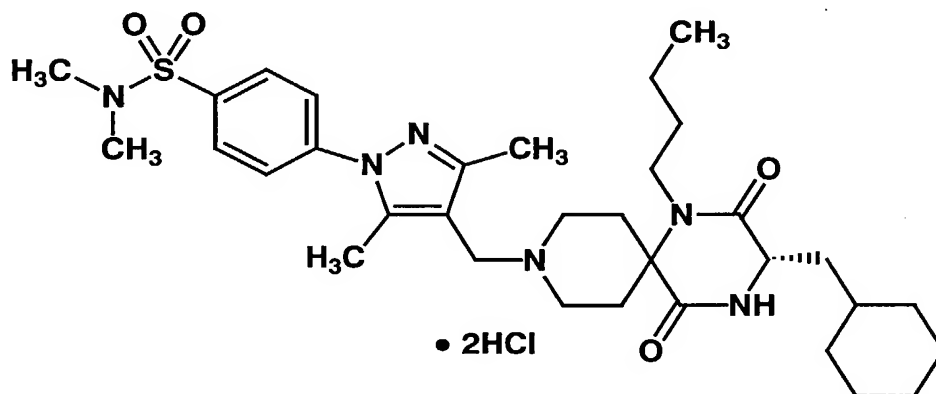
NMR (CD₃OD) : δ 8.19 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.61 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.06 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.80 (m, 2H), 3.61 (m, 2H), 3.43-3.38 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.40 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.75-1.18 (m, 15H), 0.96 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5

実施例 40 (41)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (ジメチルアミノスルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

10



TLC : R_f 0.54 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.96 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.78 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.74 (m, 2H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 2.74 (s, 6H), 2.59 (m, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.29-2.10 (m, 2H), 1.84-1.16 (m, 13H), 1.06-0.86 (m, 5H)。

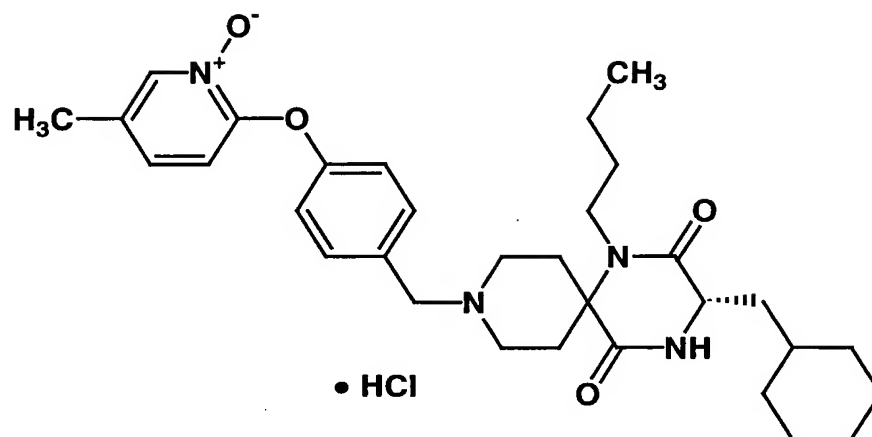
15

実施例 40 (42)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (5 - メチルピリジン - 1 - オキシド - 2 - イルオキシ) フェニル

20

メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

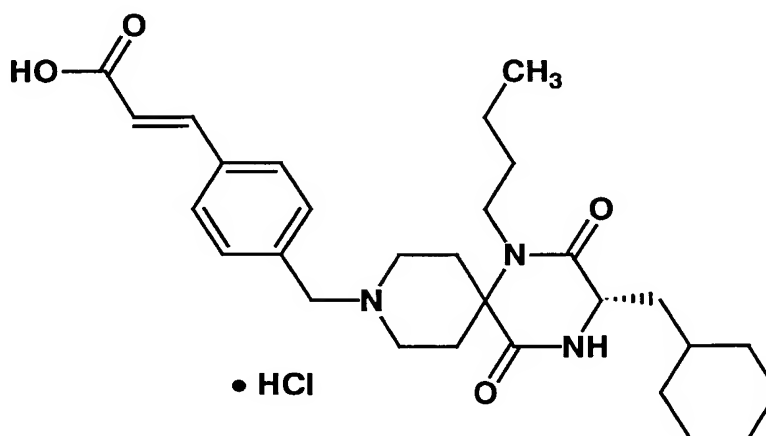


TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.77 (brs, 1H), 7.61 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.56 (dd, J = 9.3, 2.4 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 6.73 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.34 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.69 (m, 2H), 3.52-3.35 (m, 4H), 2.44 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.84-1.14 (m, 15H), 1.04-0.96 (m, 5H)。

実施例 40 (43)

- 10 (3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(2-カルボキシ-1-エチニル)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

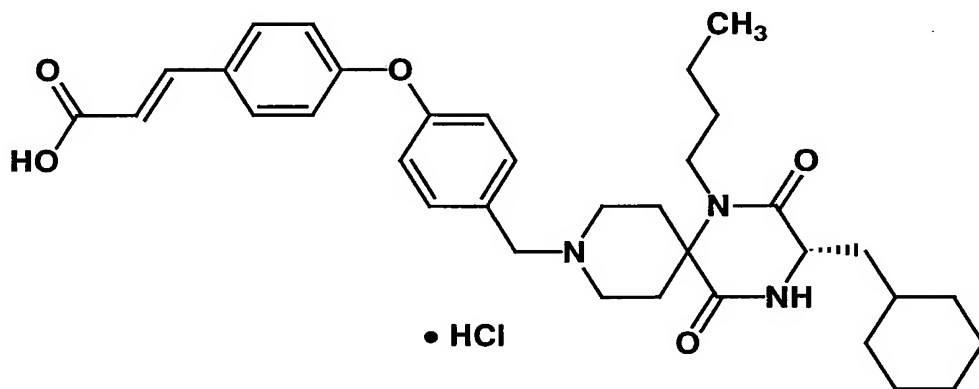


TLC : R f 0.17 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.70 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.57 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 4.39 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.92-1.10 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

实施例 40 (44)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9
- (4 - (4 - ((1E) - 2 - カルボキシ - 1 - エチニル) フェニルオキ
シ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・
塩酸塩



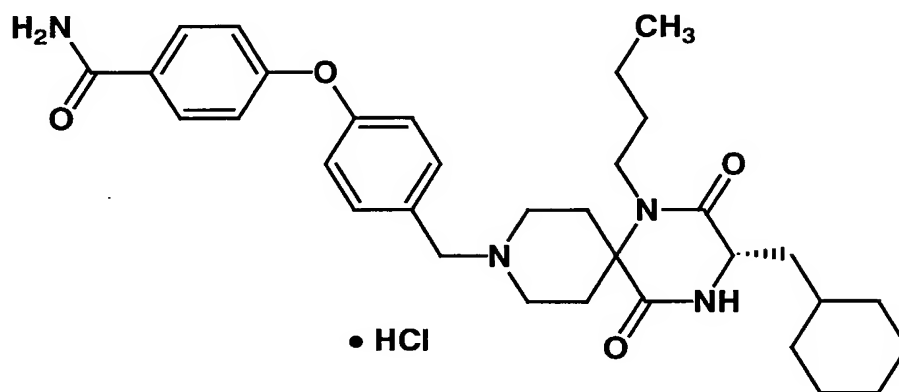
TLC : Rf 0.44 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.69-7.63 (m, 3H), 7.57 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.14 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.05 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.42 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.74 (m, 2H), 3.55-3.36 (m, 4H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

实施例 40 (45)

20 (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9

－（４－（４－アミノカルボニルフェニルオキシ）フェニルメチル）－１，
４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン・塩酸塩

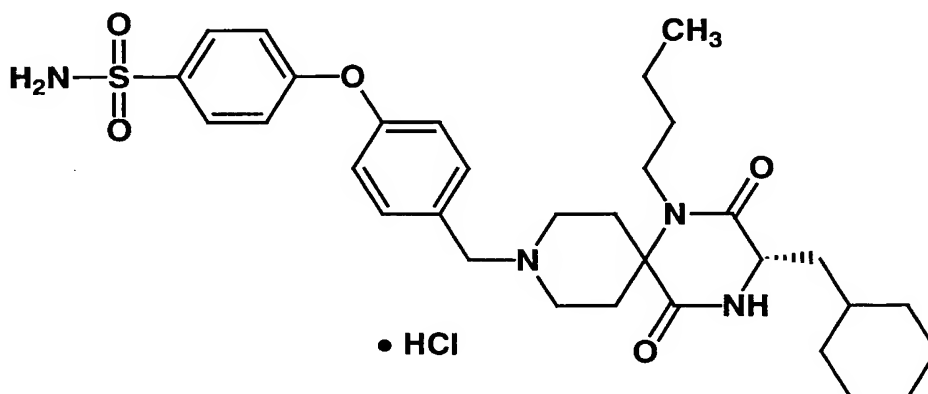


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

5 NMR (CD₃OD) : δ 7.90 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5, Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.56-3.35 (m, 4H), 2.53-2.35 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.84-1.13 (m, 15H), 1.06-0.86 (m, 5H)。

10 実施例 40 (46)

(3S)－１－ブチル－２，５－ジオキソ－３－シクロヘキシルメチル－９－
－（４－（４－アミノスルホニルフェニルオキシ）フェニルメチル）－１，
４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン・塩酸塩



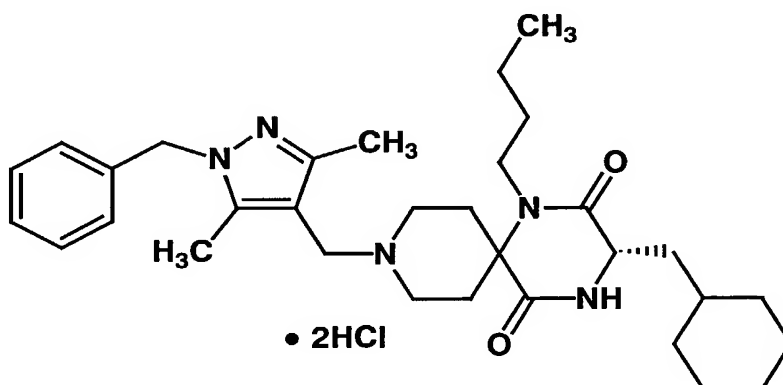
TLC : Rf 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (d_6 -DMSO) : δ 11.03 (brs, 1H), 8.42 (brs, 1H), 7.82 (d, J = 8.7 Hz, 2H),
7.71 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.33 (brs, 2H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 4H), 4.38-4.23 (m,
2H), 3.91 (m, 1H), 3.61-3.23 (m, 6H), 2.58-2.30 (m, 2H), 2.18-1.91 (m, 2H),

5 1.76-1.00 (m, 15H), 0.98-0.71 (m, 5H)。

実施例 40 (47)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9
- (3, 5 - ジメチル - 1 - ベンジルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1,
10 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩酸塩



TLC : Rf 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD_3OD) : δ 7.41-7.33 (m, 3H), 7.22-7.20 (m, 2H), 5.46 (s, 2H), 4.31 (s,
2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.74 (m, 2H), 3.58-3.48 (m, 4H), 2.61
15 (m, 2H), 2.47 (s, 6H), 2.24-2.09 (m, 2H), 1.80-1.16 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz,
3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 40 (48)

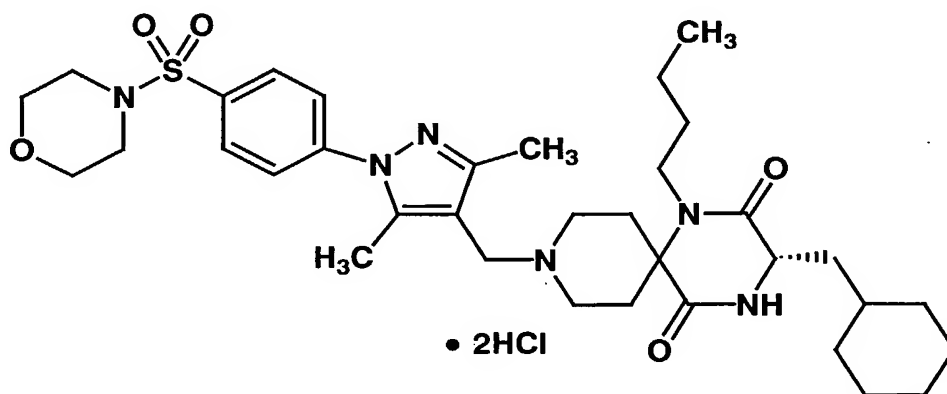
(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9
20 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) ピラゾール -

TLC : Rf 0.14 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.74 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.65 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.56-3.38 (m, 6H), 3.28-3.10 (m, 2H), 2.66-2.48 (m, 2H), 2.26-1.92 (m, 6H), 1.83-1.10 (m, 15H), 1.06-0.83 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (50)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (モルホニン - 4 - イルスルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩酸塩

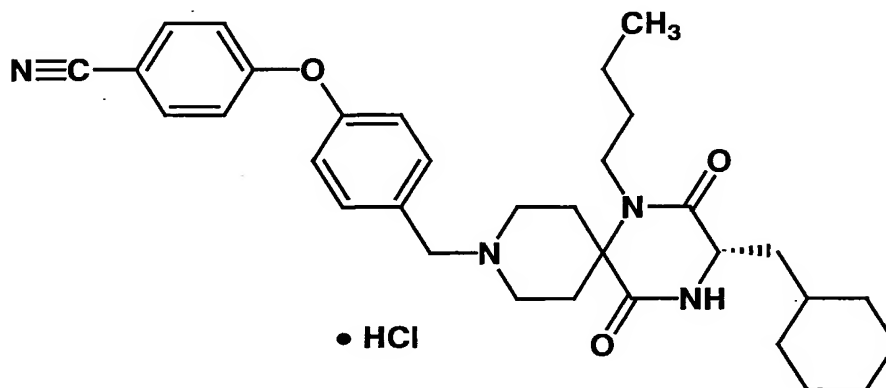


TLC : Rf 0.46 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.95 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.80 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.74 (m, 2H), 3.76-3.67 (m, 4H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.56-3.42 (m, 2H), 3.10-2.92 (m, 4H), 2.68-2.50 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.84-1.08 (m, 15H), 1.08-0.83 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

20 実施例 40 (51)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-
 -(4-(4-シアノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-ト
 リアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

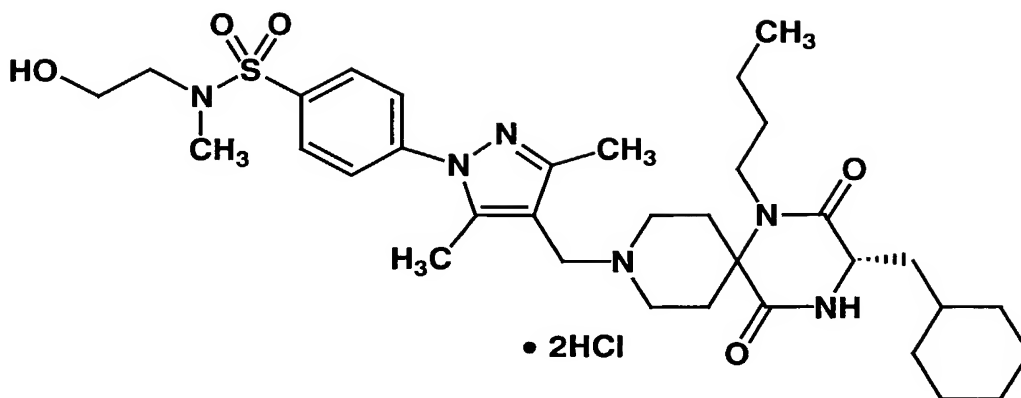


- 5 TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 9.3 Hz, 2H), 7.64 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.22 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.14 (d, J = 9.3 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.74 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.52-2.36 (m, 2H), 2.32-2.08 (m, 2H), 1.84-1.12 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

10

実施例 40 (52)

- (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-
 -(3,5-ジメチル-1-(4-(N-(2-ヒドロキシエチル)-N-
 メチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,
 15 4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

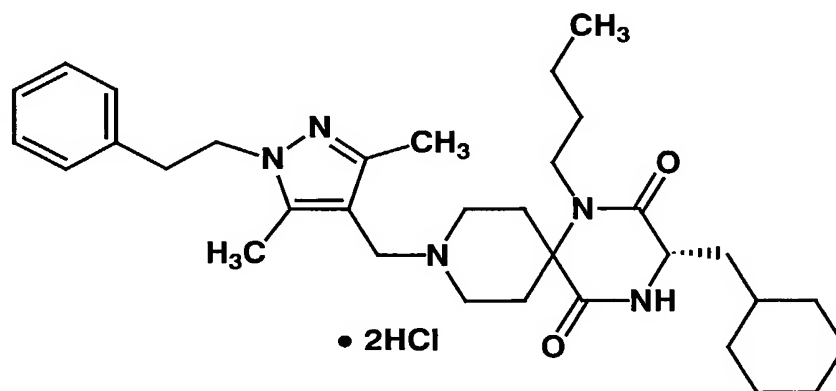


TLC : R_f 0.68 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.00 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.78 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.06 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.76 (m, 2H), 3.70 (t, J = 5.7 Hz, 2H),
 5 3.68-3.60 (m, 2H), 3.58-3.42 (m, 2H), 3.20 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 2.88 (s, 3H), 2.72-2.58 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 40 (53)

- 10 (3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-
 - (3, 5-ジメチル-1-(2-フェニルエチル)ピラゾール-4-イル
 メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



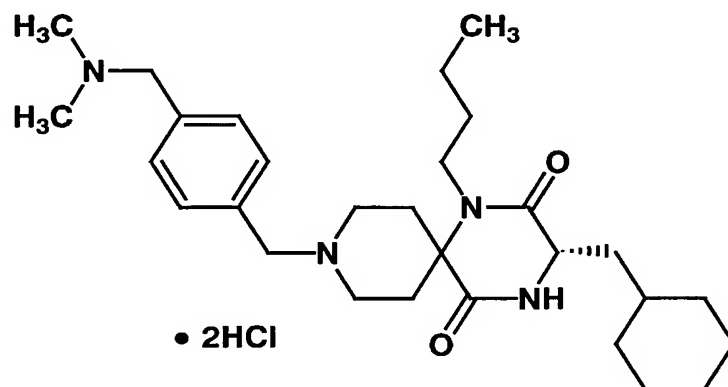
TLC : R_f 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.28-7.23 (m, 3H), 7.10 - 7.07 (m, 2H), 4.40 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 4.19 (s, 2H), 4.06 (dd, J = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 3.80-3.60 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 3.12 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.64-2.45 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.26-2.04 (m, 2H), 1.95 (s, 3H), 1.84-1.14 (m, 15H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.97 (m, 2H)。

5

実施例 40 (54)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (ジメチルアミノメチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



10

TLC : R_f 0.16 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

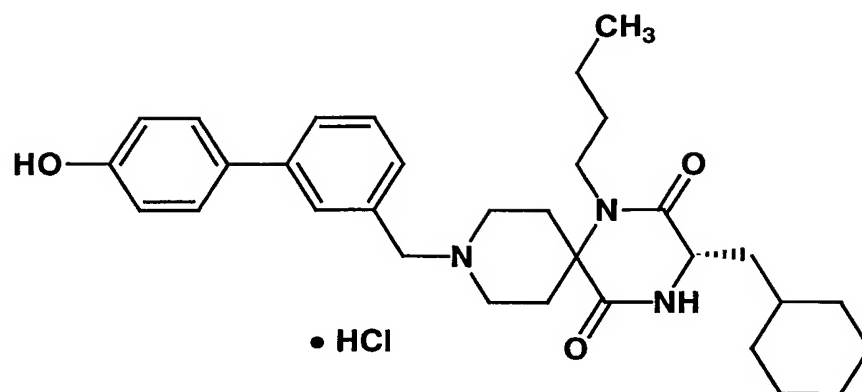
NMR (CD₃OD) : δ 7.76 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.63 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 5.1 Hz, 1H), 3.90-3.75 (m, 2H), 3.52-3.38 (m, 4H), 2.87 (s, 6H), 2.64-2.48 (m, 2H), 2.22-2.04 (m, 2H), 1.80-1.15 (m, 15H),

15 1.00-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (55)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3 - (4 - ヒドロキシフェニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

20

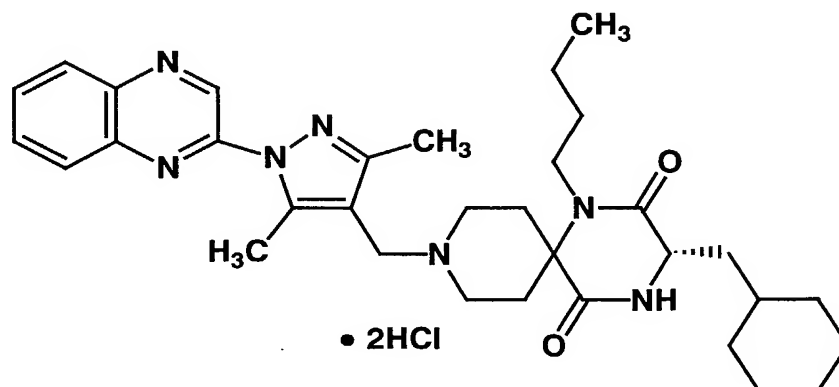


TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.81 (s, 1H), 7.69 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.55-7.48 (m, 1H), 7.45 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.92-3.73 (m, 2H), 3.58-3.43 (m, 2H), 3.43-3.32 (m, 2H), 2.55-2.35 (m, 2H), 2.28-2.06 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.08-0.83 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (56)

- 10 (3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-
- (3, 5-ジメチル-1-(キノキサリン-2-イル)ピラゾール-4-
イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸
塩

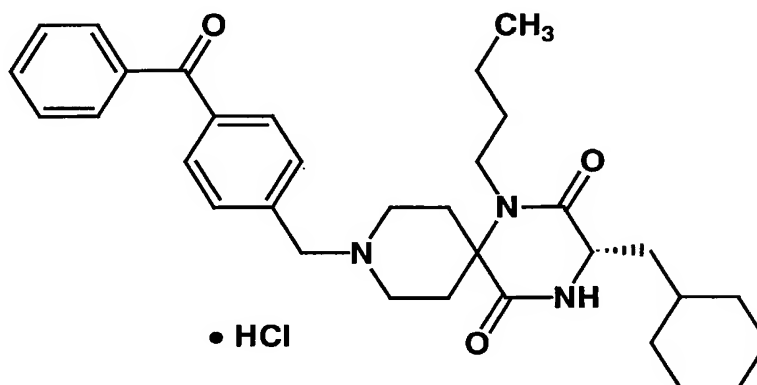


TLC : R_f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 9.51 (s, 1H), 8.13 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.0 Hz, 1H),
7.91-7.80 (m, 2H), 4.38 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.82 (m, 2H),
3.63 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.47 (s, 3H), 2.47 (m, 2H), 2.29-2.16
5 (m, 2H), 1.80-1.18 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 40 (57)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9
- (4 - (フェニルカルボニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザ
10 スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



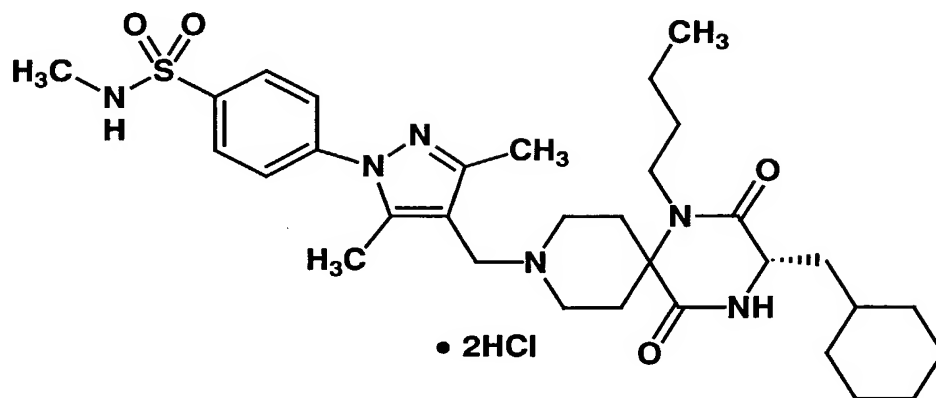
TLC : R_f 0.68 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.87 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.82-7.74 (m, 4H), 7.67 (t, J = 8.4
Hz, 1H), 7.57-7.51 (m, 2H), 4.48 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.78
15 (m, 2H), 3.58-3.38 (m, 4H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.82-1.14 (m,
15H), 1.02-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (58)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9
20 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルアミノスルホニルフェニル) ピラ

ゾールー４－イルメチル)－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン・２塩酸塩

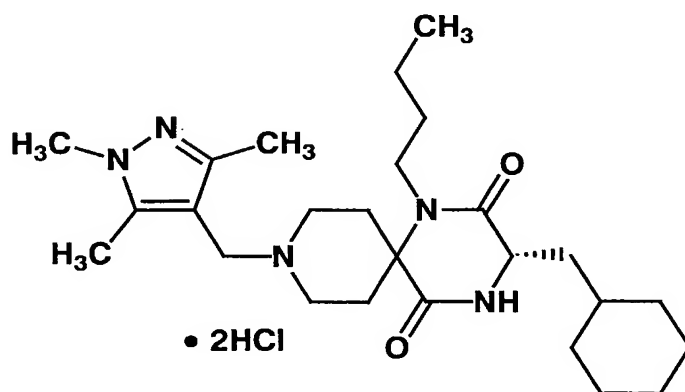


TLC : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.74 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.06 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.78 (m, 2H), 3.68-3.58 (m, 2H), 3.52-3.36 (m, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.59-2.38 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.34-2.10 (m, 2H), 1.84-1.16 (m, 15H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.97 (m, 2H)。

10 実施例 40 (59)

(3S)－１－ブチル－２，５－ジオキソ－３－シクロヘキシルメチル－９－（１，３，５－トリメチルピラゾール－４－イルメチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン・２塩酸塩



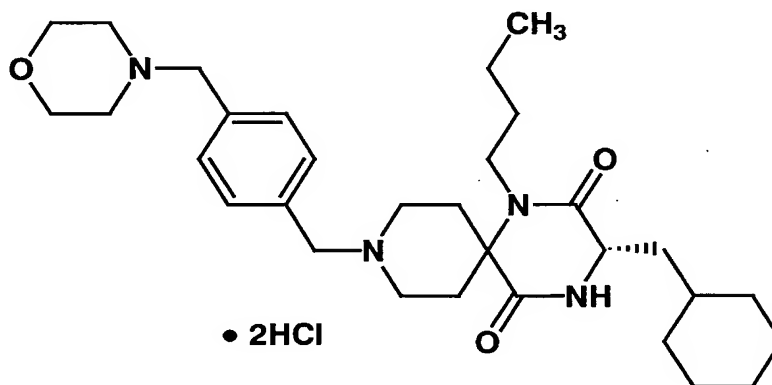
TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.28 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.87-3.69 (m, 2H), 3.61-3.43 (m, 4H), 2.69-2.50 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.25-2.06 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.05-0.86 (m, 5H)。

5

実施例 40 (60)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩酸塩



10

TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

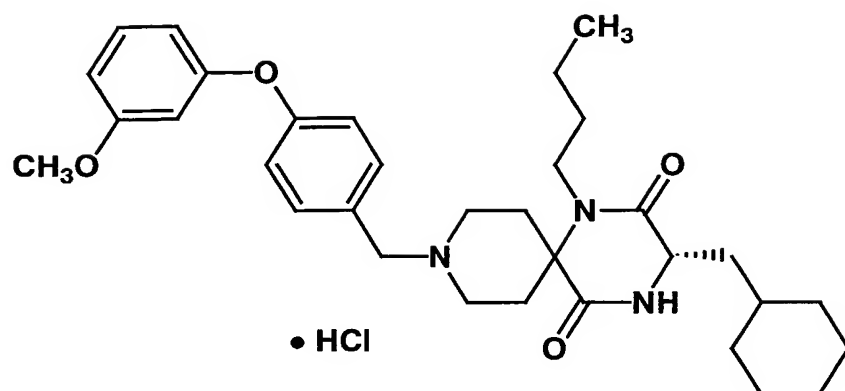
NMR (CD₃OD) : δ 7.74 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.66 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40 (s, 4H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 4.00-3.70 (m, 6H), 3.54-3.40 (m, 4H), 3.35-3.18 (m, 4H), 2.63-2.47 (m, 2H), 2.24-2.02 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.06-0.85 (m, 5H)。

15

実施例 40 (61)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (3 - メトキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩酸塩

20

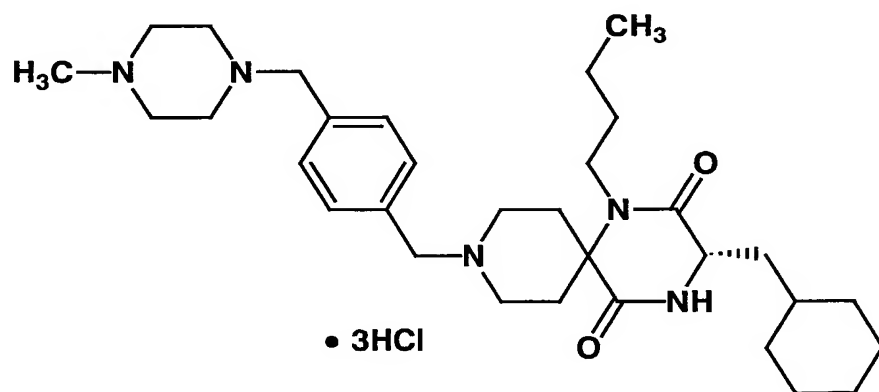


TLC : R_f 0.57 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.28 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.75 (ddd, J = 8.4, 2.4, 1.0 Hz, 1H), 6.61-6.57 (m, 2H), 4.34 (s, 2H),
 5 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.85-3.55 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.53-3.47 (m, 2H),
 3.40 (m, 2H), 2.50-2.35 (m, 2H), 2.25-2.11 (m, 2H), 1.80-1.23 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

実施例 40 (62)

10 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 -
 - (4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イルメチル) フェニルメチル) - 1,
 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・3 塩酸塩

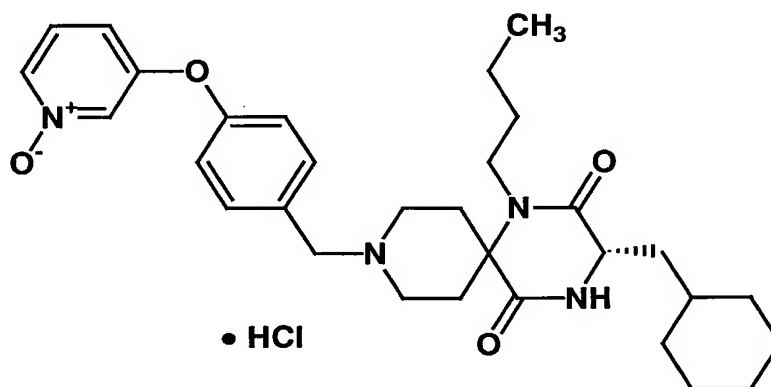


TLC : R_f 0.69 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.74 (s, 4H), 4.54 (s, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.87-3.42 (m, 14H), 3.00 (s, 3H), 2.61-2.46 (m, 2H), 2.21-2.07 (m, 2H), 1.79-1.15 (m, 15H), 1.02-0.92 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5 実施例 40 (63)

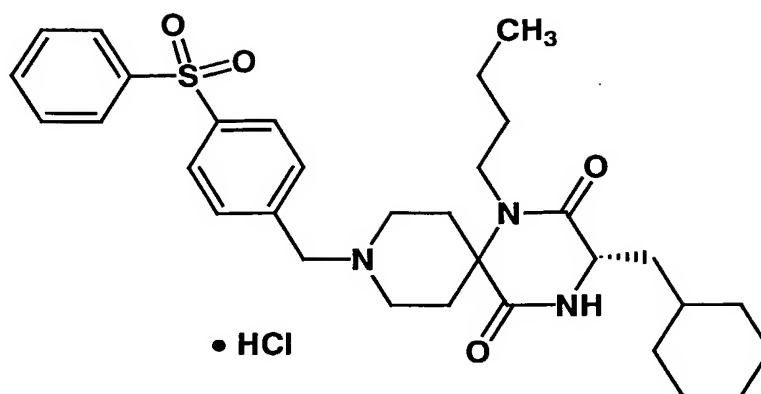
(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (ピリジン - 1 - オキシド - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



- 10 TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.45 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 8.37 (brd, J = 6.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 8.4, 6.3 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.59 (brdd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8 Hz, 1H), 3.90-3.74 (m, 2H), 3.57-3.40 (m, 4H), 2.58-2.40 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H),
 15 1.04-0.90 (m, 5H)。

実施例 40 (64)

- (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - フェニルスルホニルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩
- 20

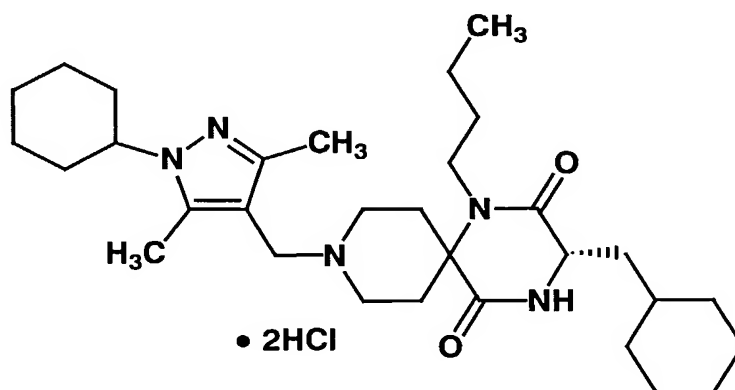


TLC : R_f 0.77 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.08 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.02-7.96 (m, 2H), 7.80 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.70-7.55 (m, 3H), 4.43 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.89-3.73 (m, 2H), 3.49-3.34 (m, 4H), 2.48-2.33 (m, 2H), 2.23-2.04 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 1.03-0.85 (m, 5H)。

実施例 40 (65)

(3S) - 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-
10 - (3,5-ジメチル-1-シクロヘキシルピラゾール-4-イルメチル)
- 1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



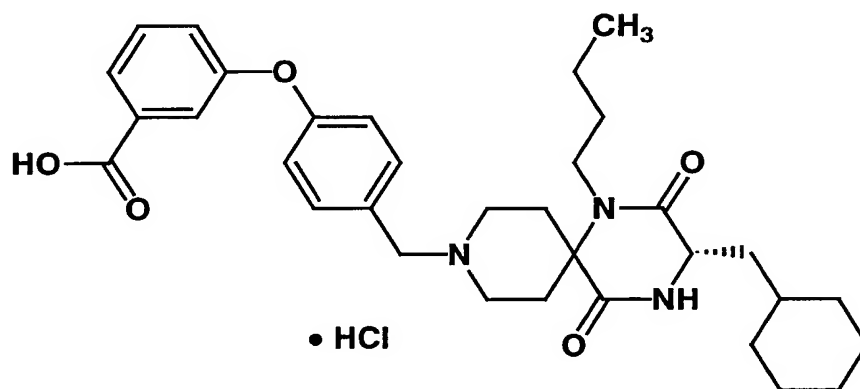
TLC : R_f 0.32 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.42-4.28 (m, 1H), 4.28 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz,

1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.60-3.43 (m, 4H), 2.68-2.50 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.25-2.06 (m, 2H), 2.04-1.15 (m, 25H), 1.05-0.89 (m, 5H)。

実施例 40 (66)

- 5 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 -
 - (4 - (3 - カルボキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 -
 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



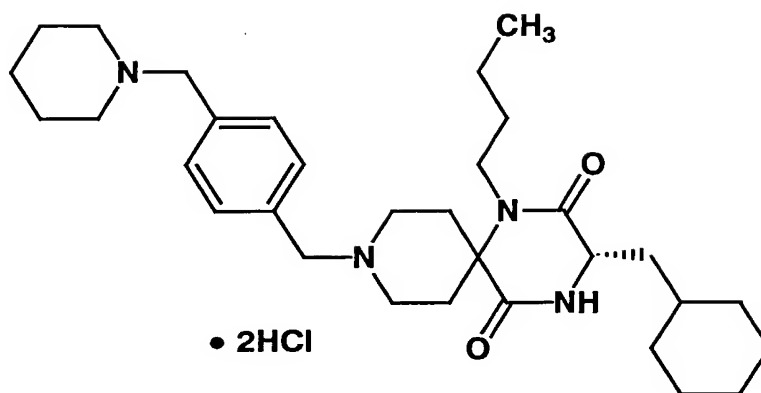
TLC : R_f 0.16 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.83 (ddd, J = 7.8, 1.5, 1.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 2.4, 1.5 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.51 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.29 (ddd, J = 7.8, 2.4, 1.2 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.35 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.74 (m, 2H), 3.58-3.35 (m, 4H), 2.49-2.34 (m, 2H), 2.28-2.09 (m, 2H), 1.93-1.10 (m, 15H), 1.07-0.85 (m, 5H)。

15

実施例 40 (67)

- (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 -
 - (4 - (ピペリジン - 1 - イルメチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 -
 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

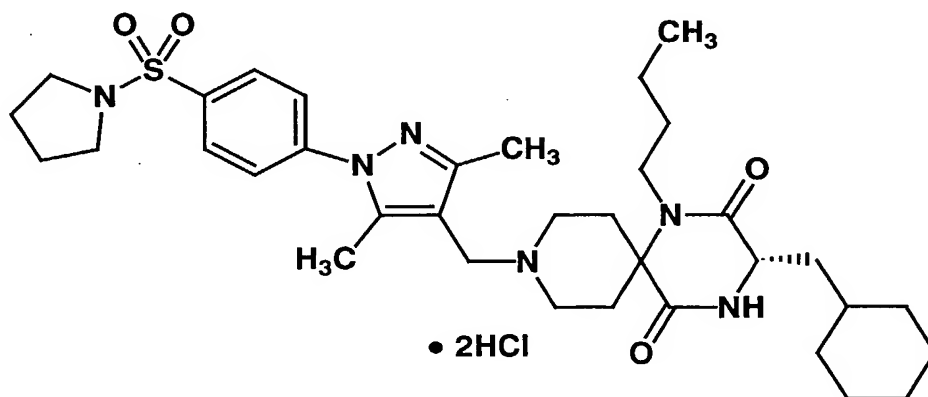


TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.64 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.53-3.38 (m, 6H), 3.05-2.91 (m, 2H), 2.66-2.49 (m, 2H), 2.24-2.04 (m, 2H), 2.00-1.13 (m, 21H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (68)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (ピロリジン - 1 - イルスルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



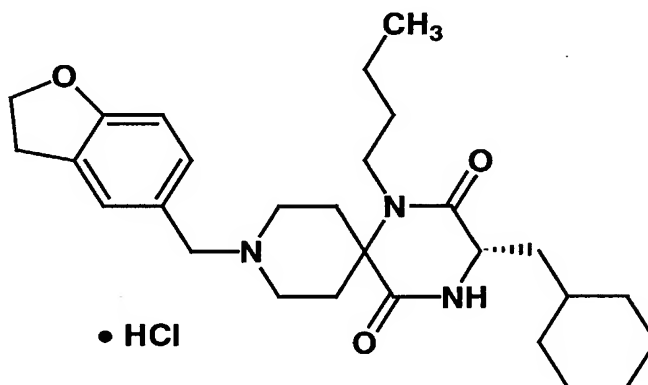
TLC : R_f 0.40 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.76 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.75 (m, 2H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.49-3.41 (m, 2H), 3.32-3.25 (m, 4H), 2.60-2.46 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.30-2.11 (m, 2H), 1.83-1.14 (m, 19H), 1.05-0.87 (m, 5H)。

5

実施例 40 (69)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : R_f 0.61 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

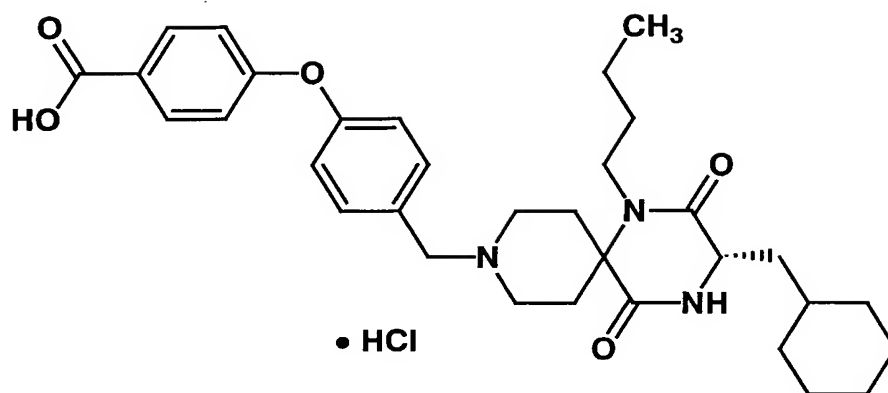
NMR (CD₃OD) : δ 7.39 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.59 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 4.26 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.67 (m, 2H), 3.54-3.34 (m, 4H), 3.25 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 2.48-2.31 (m, 2H), 2.26-2.07 (m, 2H), 1.83-1.14 (m, 15H), 1.04-0.87 (m, 5H)。

15

実施例 40 (70)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - カルボキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

20

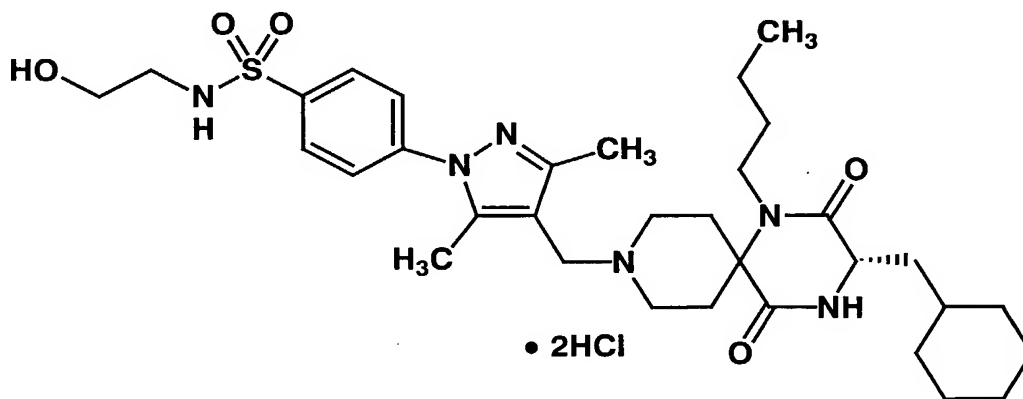


TLC : R_f 0.55 (酢酸エチル : メタノール = 9 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.04 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.61 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.38 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H),
 5 3.91-3.74 (m, 2H), 3.57-3.35 (m, 4H), 2.50-2.33 (m, 2H), 2.29-2.09 (m, 2H),
 1.84-1.14 (m, 15H), 1.05-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (71)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9
 10 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (2 - ヒドロキシエチルアミノスルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピ
 ロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

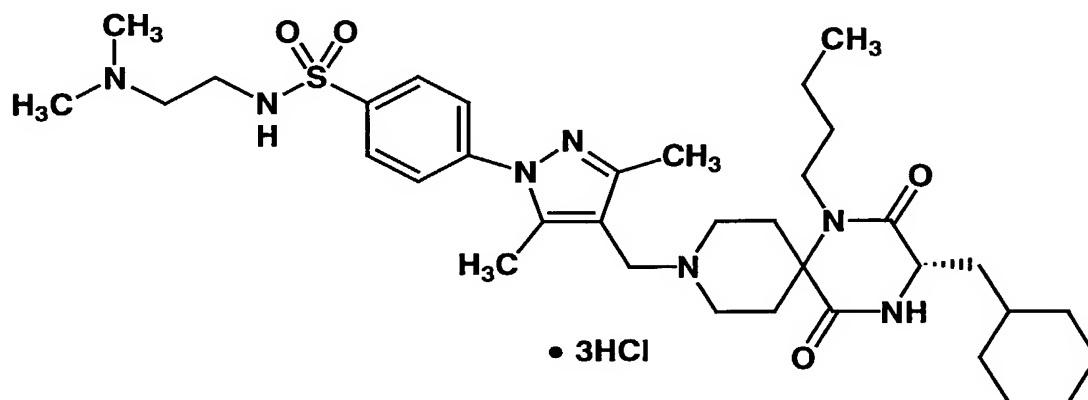


TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.03 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.72 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.94-3.74 (m, 2H), 3.66-3.56 (m, 2H), 3.56 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 3.51-3.41 (m, 2H), 3.01 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 2.63-2.43 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.32-2.10 (m, 2H), 1.93-1.10 (m, 15H), 1.06-0.93 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (72)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (2 - ジメチルアミノエチルアミノスルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・3 塩酸塩

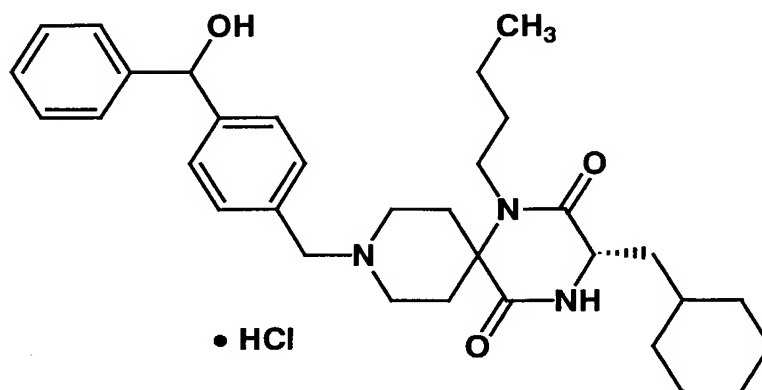


TLC : R_f 0.13 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.79 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.2 Hz, 1H), 3.82-3.76 (m, 2H), 3.68-3.48 (m, 4H), 3.34-3.24 (m, 4H), 2.95 (s, 6H), 2.76-2.52 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 2.25-2.08 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (73)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9

－（４－（１－ヒドロキシ－１－フェニルメチル）フェニルメチル）－１，
４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン・塩酸塩

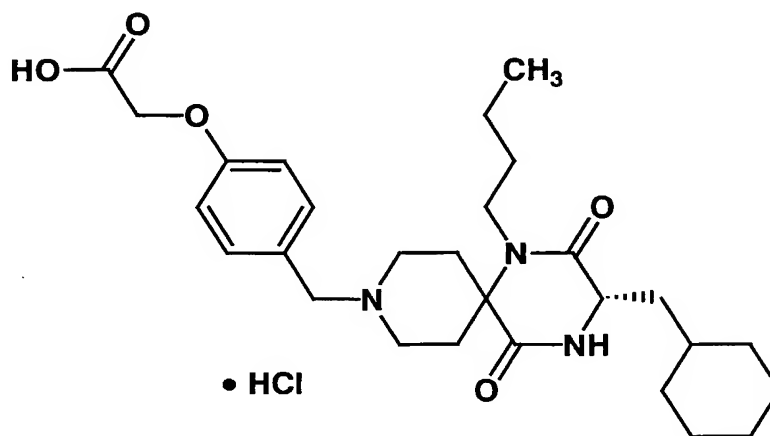


TLC : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

5 NMR (CD₃OD) : δ 7.62-7.18 (m, 9H), 5.82 (s, 1H), 4.34 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 2H), 3.58-3.30 (m, 4H), 2.42-2.04 (m, 4H), 1.82-1.24 (m, 15H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.94 (m, 2H)。

実施例 40 (74)

10 (3S)－１－ブチル－２，５－ジオキソ－３－シクロヘキシルメチル－９
－（４－（カルボキシメチルオキシ）フェニルメチル）－１，４，９－トリ
アザスピロ〔５．５〕ウンデカン・塩酸塩

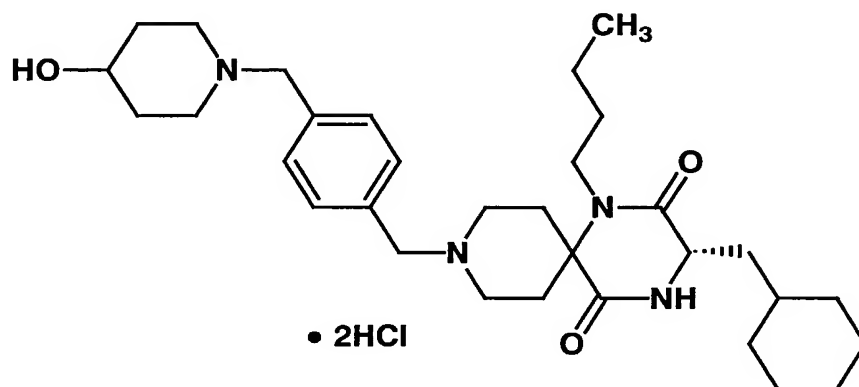


TLC : R_f 0.30 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.70 (s, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.69 (m, 2H), 3.54-3.33 (m, 4H), 2.44-2.28 (m, 2H), 2.26-2.06 (m, 2H), 1.83-1.12 (m, 15H), 1.04-0.85 (m, 5H)。

実施例 40 (75)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イルメチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩酸塩



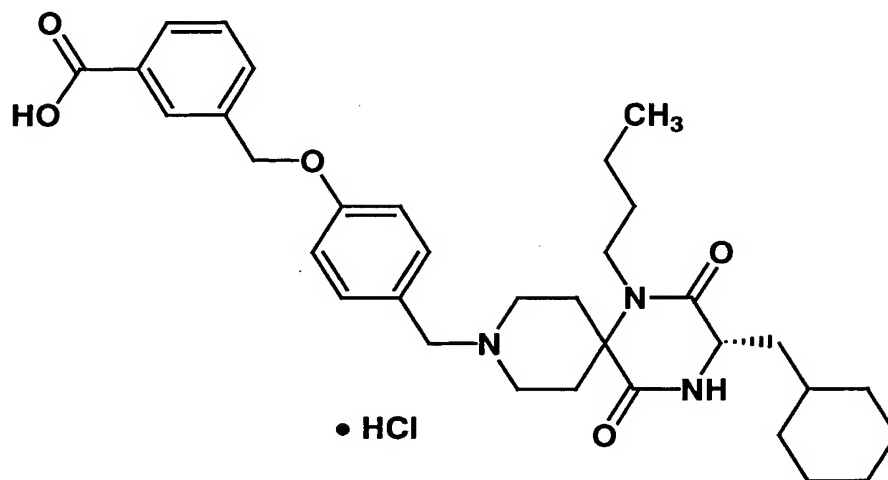
TLC : R_f 0.17 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.76 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.70-7.61 (m, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.38-4.32 (m, 2H), 4.10-4.05 (m, 1H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.68 (m, 2H), 3.56-3.40 (m, 4H), 3.18-3.00 (m, 1H), 2.70-2.48 (m, 2H), 2.23-1.82 (m, 5H), 1.82-1.10 (m, 19H), 1.06-0.83 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 40 (76)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (3 - カルボキシフェニルメチルオキシ) フェニルメチル) - 1,

4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

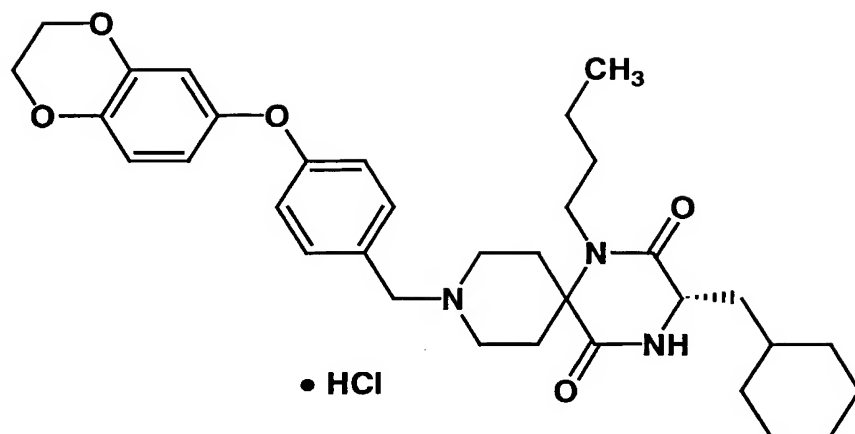


TLC : R_f 0.57 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.10 (s, 1H), 7.98 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.50 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 5.22 (s, 2H), 4.28 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.68 (m, 2H), 3.52-3.32 (m, 4H), 2.42-2.08 (m, 4H), 1.82-1.16 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

10 実施例 40 (77)

(3S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

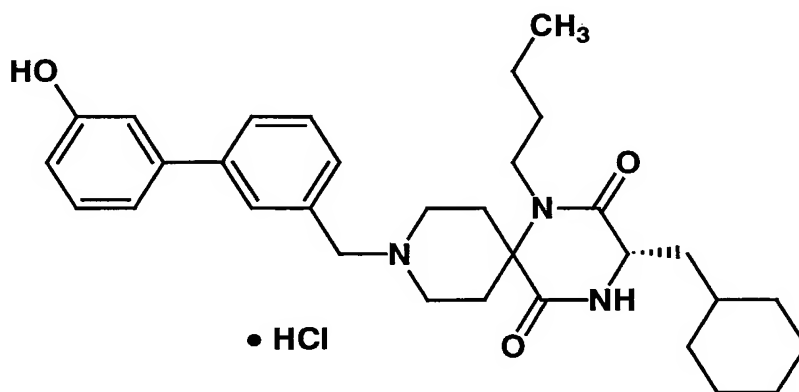


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.86 (m, 1H), 6.55 - 6.51 (m, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.24 (s, 4H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H),
 5 3.86-3.70 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.42-2.08 (m, 4H), 1.82-1.12 (m, 15H),
 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 40 (78)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9
 10 - (3 - (3 - ヒドロキシフェニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



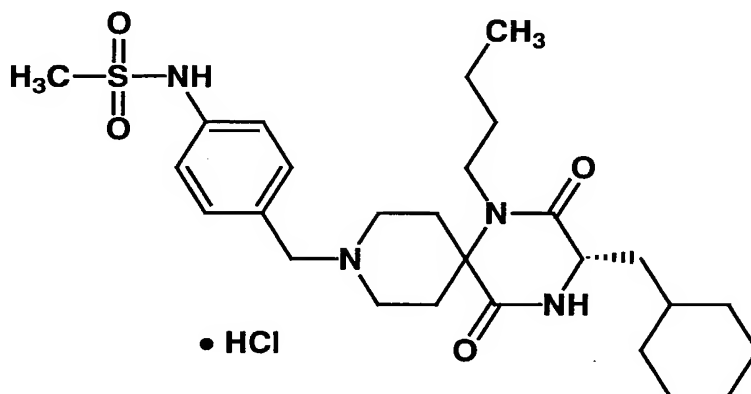
TLC : R_f 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.81 (s, 1H), 7.74 (m, 1H), 7.60-7.50 (m, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.15-7.08 (m, 2H), 6.82 (m, 1H), 4.43 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.78 (m, 2H), 3.58-3.34 (m, 4H), 2.48-2.08 (m, 4H), 1.84-1.12 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

5

実施例 40 (79)

(3S) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (メチルスルホニルアミノ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

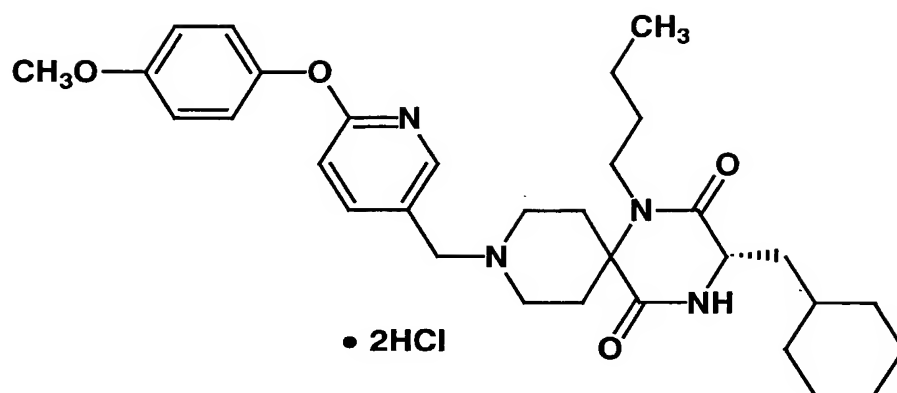
NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.34 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.86-3.72 (m, 2H), 3.52-3.34 (m, 4H), 3.01 (s, 3H), 2.50-2.32 (m, 2H), 2.24-2.06 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.86 (m,

15

実施例 40 (80)

(3S) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (6 - (4 - メトキシフェニル) ピリジン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

20

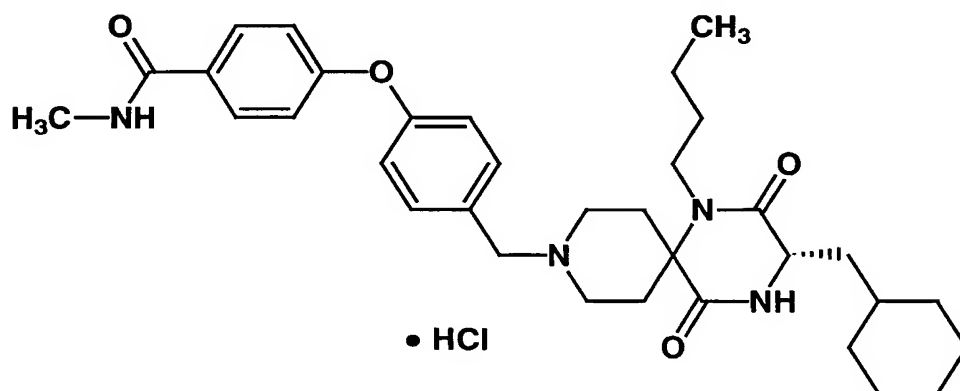


TLC : R f 0.67 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.26 (m, 1H), 8.02 (m, 1H), 7.08-6.84 (m, 5H), 4.38 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.90-3.72 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.56-3.44 (m, 2H), 3.42-3.32 (m, 2H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

实施例 40 (81)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9
10 - (4-(4-メチルアミノカルボニルフェニルオキシ)フェニルメチル)-
1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.46 (クロロホルム：メタノール=10：1)；

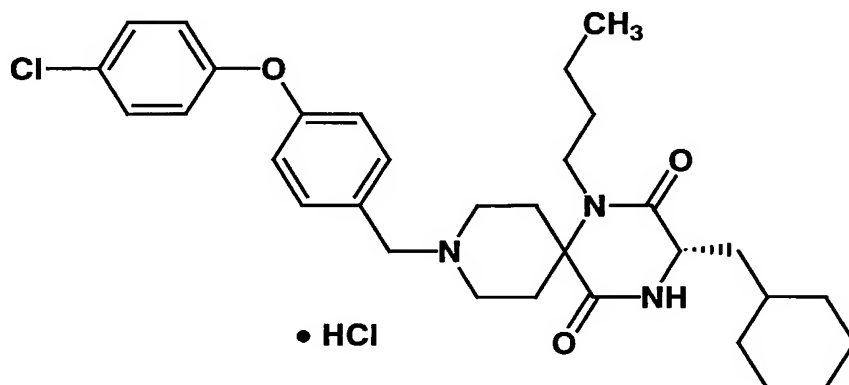
NMR (CD₃OD) : δ 8.39 (br d, J = 4.5 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.58 (d,

J = 8.4 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.35 (s, 2H), 4.04 (m, 1H), 3.85-3.74 (m, 2H), 3.53-3.38 (m, 4H), 2.91 (d, J = 4.5 Hz, 3H), 2.55-2.30 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.10-0.90 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5

実施例 40 (82)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(4-クロロフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

TLC: R_f 0.76 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;

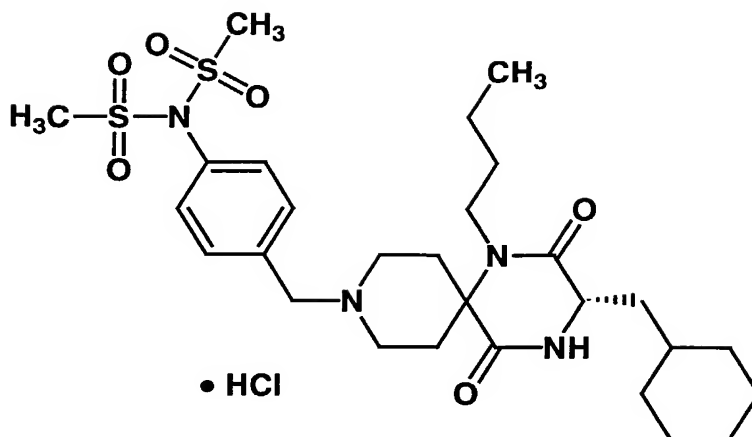
NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.09 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.04 (m, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.60-3.30 (m, 4H), 2.50-2.10 (m, 4H), 1.90-1.10 (m, 15H), 1.10-0.90 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

15

実施例 40 (83)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-ビス(メチルスルホニル)アミノフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

20

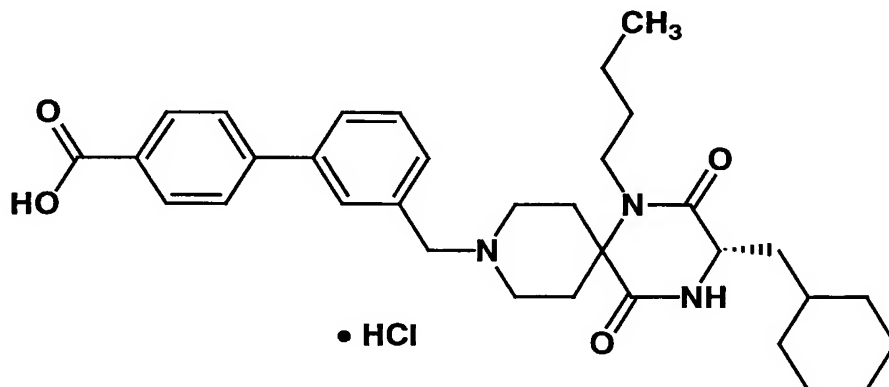


TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.69 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.70 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 3.47 (s, 6H), 2.46-2.08 (m, 4H), 1.84-1.16 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 40 (84)

(3S)-1-(4-(4-カルボキシフェニル)ベンジル)ピペリジン-4-カルボキシアミド・塩酸塩
10 - (3-(4-カルボキシフェニル)フェニルメチル)-1,4,9-トリ
アザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



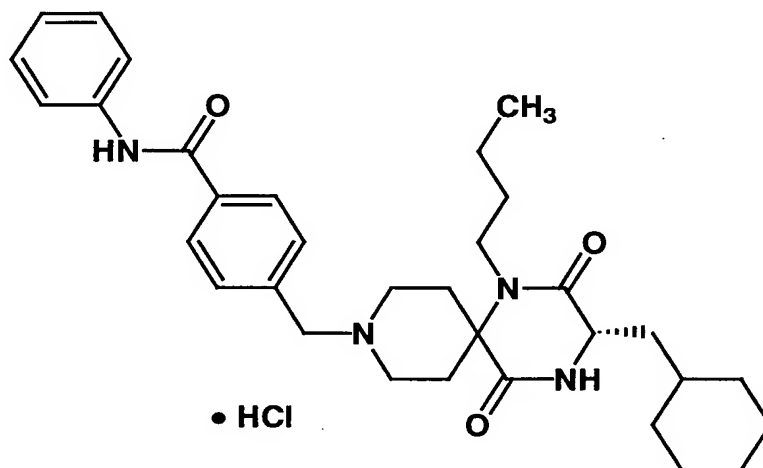
TLC : R_f 0.60 (クロロホルム : メタノール = 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.13 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.95 (s, 1H), 7.84 (m, 1H), 7.82 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.66-7.61 (m, 2H), 4.46 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.96-3.78 (m, 2H), 3.62-3.36 (m, 4H), 2.54-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.82-1.08 (m, 15H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.95 (m, 2H)。

5

実施例 40 (85)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (フェニルアミノカルボニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : R_f 0.25 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

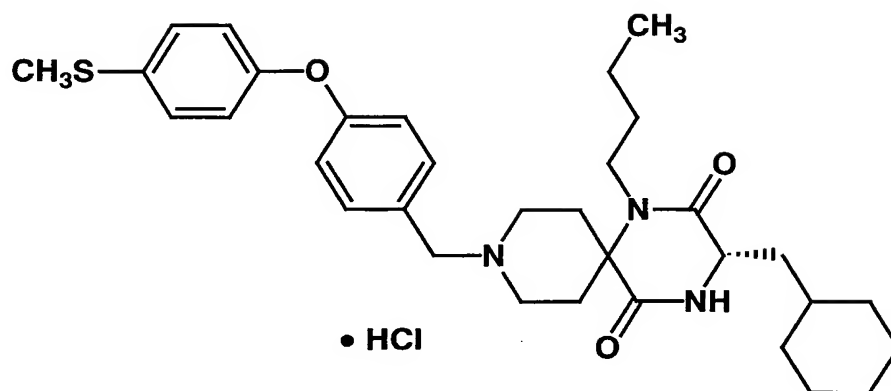
NMR (CD₃OD) : δ 8.07 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.73-7.67 (m, 2H), 7.71 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.38 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 4.45 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.72 (m, 2H), 3.58-3.36 (m, 4H), 2.50-2.08 (m, 4H),

15 1.84-1.08 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.8 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 40 (86)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - メチルチオフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9

ートリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

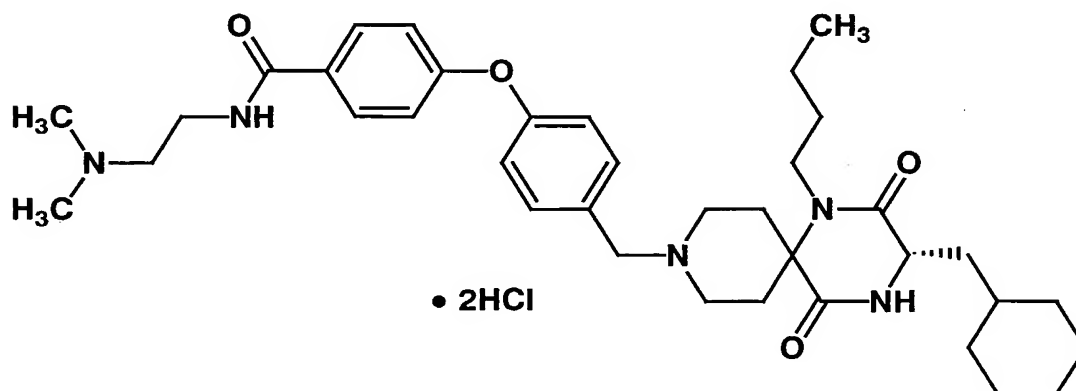


TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.33 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.86-3.70 (m, 2H), 3.56-3.36 (m, 4H), 2.48 (s, 3H), 2.48-2.32 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 2H), 1.82-1.14 (m, 15H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 40 (87)

- 10 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - (2 - ジメチルアミノエチルアミノカルボニル) フェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



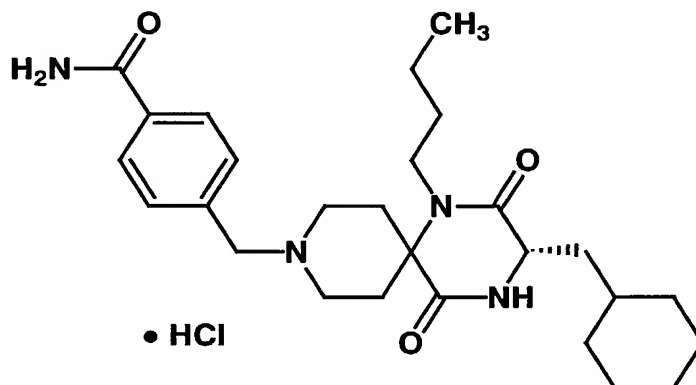
TLC : R_f 0.11 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.94 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.64 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.10 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 4H), 3.52-3.36 (m, 6H), 2.98 (s, 6H), 2.62-2.44 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.80-1.10 (m, 15H), 1.00-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (88)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - アミノカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ

10 [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



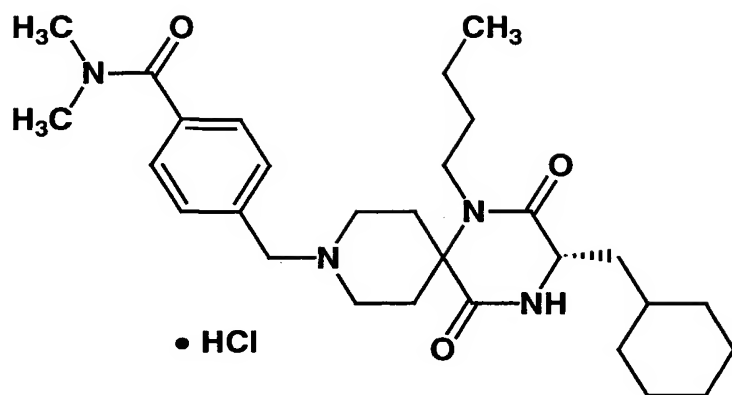
TLC : R_f 0.19 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.98 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.68 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.43 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.5, 4.8 Hz, 1H), 3.92-3.76 (m, 2H), 3.54-3.28 (m, 4H), 2.52-2.36 (m, 2H), 2.24-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.88 (m, 5H)。

実施例 40 (89)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (ジメチルアミノカルボニル)フェニルメチル) - 1, 4, 9 - ト

20 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

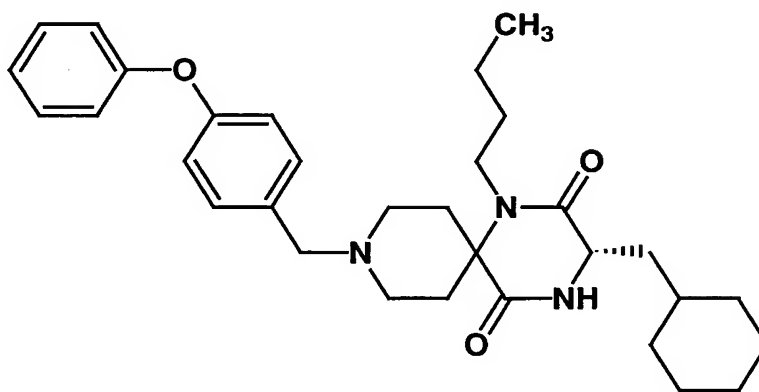


TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.67 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.2 Hz, 1H), 3.92-3.76 (m, 2H), 3.54-3.32 (m, 4H), 3.11 (s, 3H), 2.99 (s, 3H), 2.52-2.32 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 2H), 1.82-1.10 (m, 15H), 1.02-0.86 (m, 5H)。

実施例 40 (90)

(3S)-1-(4-(4-フェニルオキシフェニルメチル)ブチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-
 10 - (4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



TLC : R_f 0.73 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CDCl₃) : δ 7.37-7.25 (m, 4H), 7.10 (m, 1H), 7.04-6.98 (m, 2H), 6.96 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 5.81 (brs, 1H), 3.99 (m, 1H), 3.52 (s, 2H), 3.52-3.32 (m, 2H),

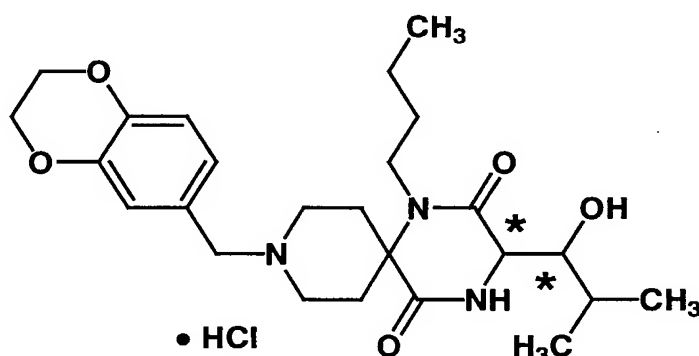
2.92-2.74 (m, 3H), 2.57 (dt, J = 12.0, 3.0 Hz, 1H), 2.18-1.88 (m, 5H), 1.76-1.13 (m, 14H), 1.07-0.88 (m, 2H), 0.93 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 4 1

- 5 参考例 2 で製造した樹脂 (3)、N-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドン、n-ブチルアミンおよび (2R*, 3R*)-N-(t-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メチルペンタン酸を用いて、参考例 3→参考例 4 と同様の操作をし、さらに 1, 4-ベンゾジオキサン-6-カルボキシアルデヒドを用いて、参考例 5→参考例 6→実施例 1
- 10 と同様の操作をし、以下の本発明化合物 (1) および (2) をそれぞれ得た。

実施例 4 1 (1)

- 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-
 15 トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



(*は、syn 体と anti 体が 2 : 3 の割合で混合していることを表す。)

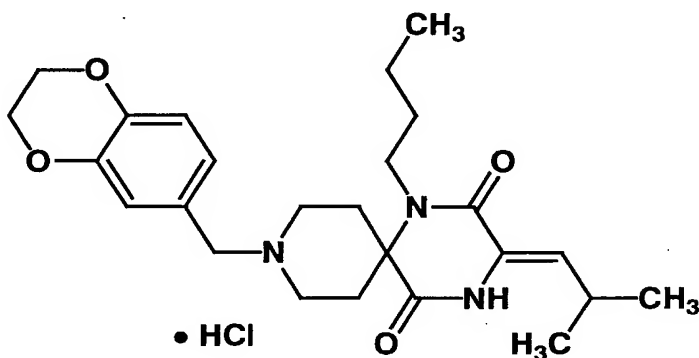
TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.13 (d, J = 2.1 Hz, 0.6H), 4.08 (d, J = 1.2 Hz, 0.4H), 4.05-3.90 (m, 1H), 3.76-3.63 (m, 1H), 3.62-3.35 (m, 3.4H),
- 20

3.19 (dd, $J = 9.6, 2.1$ Hz, 0.6H), 3.20-3.10 (m, 1H), 2.55-2.33 (m, 2H), 2.30-1.95 (m, 3H), 1.80-1.60 (m, 1H), 1.55-1.25 (m, 3H), 1.05-0.89 (m, 9H)。

実施例 4 1 (2)

- 5 (Z) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピリデン) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.97 (dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz, 1H), 6.93 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 5.84 (d, $J = 10.5$ Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 3.72-3.55 (m, 2H), 3.53-3.35 (m, 4H), 2.80-2.60 (m, 1H), 2.43-2.26 (m, 2H), 2.25-2.15 (m, 2H), 1.62-1.48 (m, 2H), 1.45-1.30 (m, 2H), 1.04 (d, $J = 6.6$ Hz, 6H), 0.95 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H)。

15

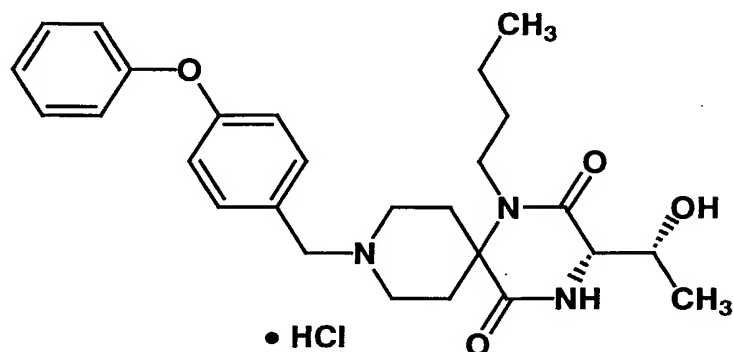
実施例 4 1 (3) ~ 4 1 (5)

- (2R*, 3R*) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン酸の代わりに相当する化合物を、1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - カルボキシアルデヒドの代わりに相当する化合物を用いて、実施例 4 1 と同様の操作をし、以下の本発明化合物得た。
- 20

実施例 4 1 (3)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - ヒドロキシエチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

5



TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

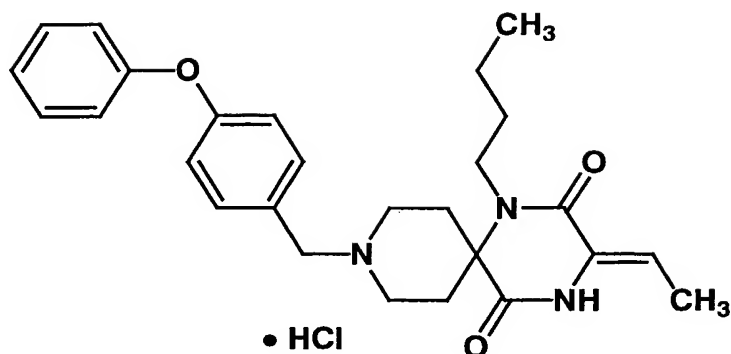
NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.21-7.14 (m, 1H), 7.08-7.00 (m, 4H), 4.32 (s, 2H), 4.19 (dq, J = 1.5, 6.9 Hz, 1H), 4.10-3.97 (m, 1H), 3.78 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.72-3.51 (m, 2H), 3.51-3.40 (m, 2H), 3.28-3.14 (m, 1H), 2.57-2.42 (m, 2H), 2.40-2.25 (m, 1H), 2.21-2.10 (m, 1H), 1.81-1.60 (m, 1H), 1.50-1.30 (m, 3H), 1.22 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

10

実施例 4 1 (4)

(Z) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - エチリデン - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

15

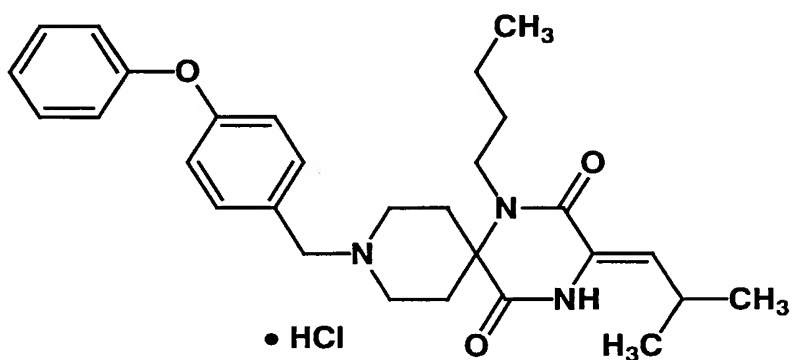


TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 4H), 6.08 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 4.33 (s, 2H), 3.76-3.61 (m, 2H), 3.57-3.40 (m, 4H), 2.45-2.30 (m, 2H), 2.28-2.15 (m, 2H), 1.77 (d, J = 7.5 Hz, 3H), 1.62-1.46 (m, 2H), 1.44-1.28 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 41 (5)

(Z) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピリデン) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



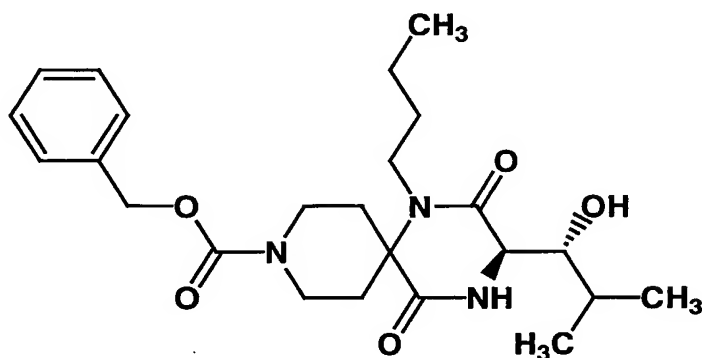
TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.08-7.01 (m, 2H), 5.85 (d, J = 10.5 Hz, 1H),

4.34 (s, 2H), 3.78-3.64 (m, 2H), 3.57-3.40 (m, 4H), 2.78-2.62 (m, 1H), 2.43-2.18 (m, 4H), 1.62-1.48 (m, 2H), 1.46-1.30 (m, 2H), 1.04 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

5 実施例 4 2

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - ベンジルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



- 10 N - (t - ブチルオキシカルボニル) - L - ロイシンの代わりに、(2 R*, 3 R*) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン酸を用いて、実施例 3 5 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

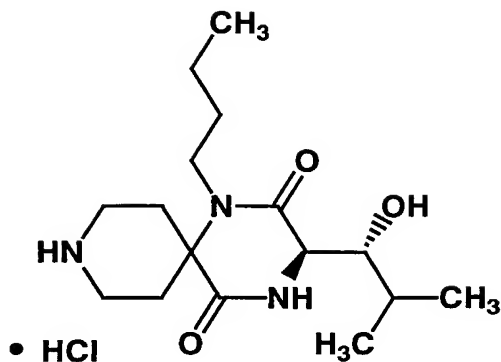
TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 15 NMR (CD₃OD) : δ 7.39-7.30 (m, 5H), 5.13 (br, 2H), 4.12 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.10-4.00 (m, 2H), 3.76-3.50 (m, 2H), 3.39-3.25 (m, 2H), 3.10-2.94 (m, 1H), 2.18 (m, 1H), 2.08-1.83 (m, 4H), 1.70-1.56 (m, 1H), 1.45-1.15 (m, 3H), 1.01-0.89 (m, 9H)。

20 実施例 4 3

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロ

キシ-2-メチルプロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウン
デカン・塩酸塩



実施例 4 2 で製造した化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下
5 の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.08 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.15 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.96 (dt, J = 13.0, 4.0 Hz, 1H), 3.71
(dt, J = 13.0, 4.0 Hz, 1H), 3.57-3.47 (m, 1H), 3.40-3.34 (m, 2H), 3.23-3.12 (m,
2H), 2.47-2.30 (m, 2H), 2.25-1.98 (m, 3H), 1.79-1.66 (m, 1H), 1.52-1.28 (m, 3H),
10 1.07-0.94 (m, 9H)。

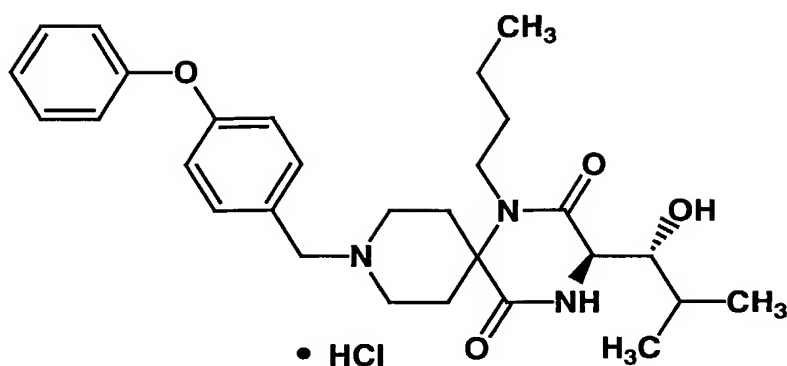
実施例 4 4 (1) ~ 4 4 (13)

実施例 4 3 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施
例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

15

実施例 4 4 (1)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロ
キシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)
-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

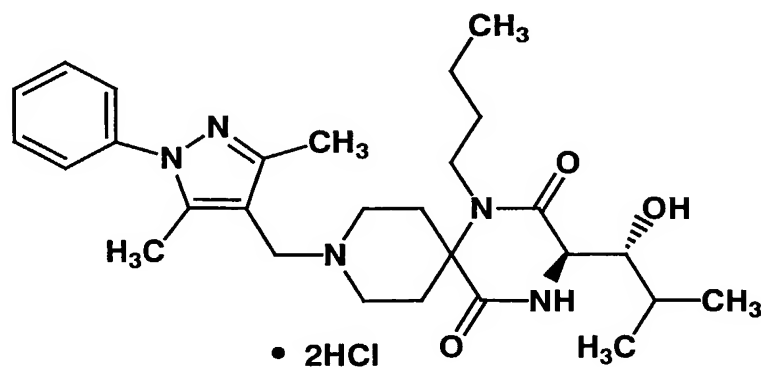


TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.44-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.06-3.93 (m, 1H), 3.80-3.67 (m, 1H), 3.56-3.40 (m, 3H), 3.19 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 3.20-3.10 (m, 1H), 2.53-2.35 (m, 2H), 2.35-2.20 (m, 1H), 2.19-2.08 (m, 1H), 2.07-1.91 (m, 1H), 1.80-1.70 (m, 1H), 1.50-1.25 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

10 実施例 44 (2)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

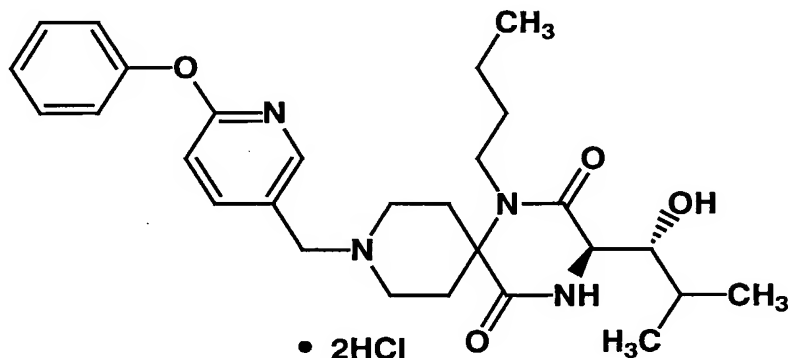


TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.45 (m, 5H), 4.30 (s, 2H), 4.15 (d, J = 2.4 Hz, 1H),
4.05 (m, 1H), 3.79 (m, 1H), 3.62-3.48 (m, 3H), 3.29-3.16 (m, 2H), 2.60-2.45 (m,
2H), 2.44-2.30 (m, 7H), 2.17 (m, 1H), 2.01 (m, 1H), 1.70 (m, 1H), 1.51-1.31 (m,
5 3H), 1.03-0.91 (m, 9H)。

実施例 44 (3)

(3R*) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*) - 1-ヒドロ
キシ-2-メチルプロピル) - 9-(6-フェニルオキシピリジン-3-イ
10 ルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

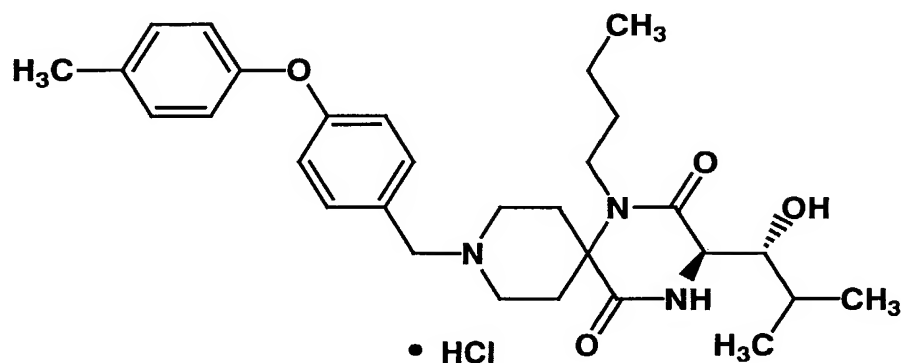


TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.16 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.46
(t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.29 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.08 (d, J =
15 8.4 Hz, 1H), 4.40 (s, 2H), 4.13 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.07-3.94 (m, 1H), 3.83-3.69
(m, 1H), 3.60-3.42 (m, 3H), 3.29-3.22 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H),
2.62-2.32 (m, 3H), 2.18-2.07 (m, 1H), 2.06-1.94 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50
-1.31 (m, 3H), 1.07-0.87 (m, 9H)。

20 実施例 44 (4)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



5

TLC: R_f 0.46 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;

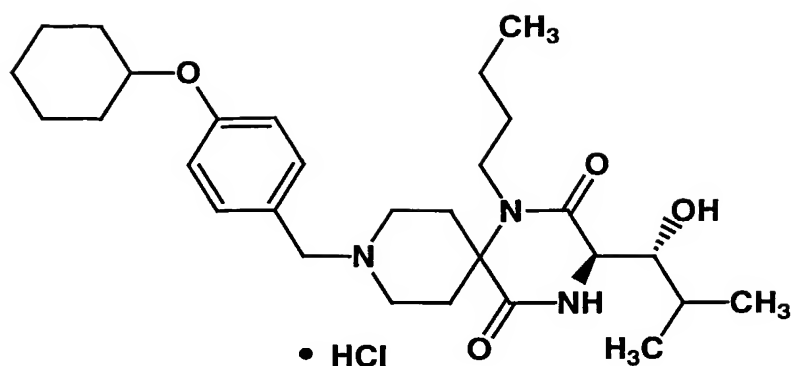
NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.20 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.02 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 3.97 (m, 1H), 3.72 (m, 1H), 3.56-3.39 (m, 2H), 3.25-3.09 (m, 3H), 2.53-2.08 (m, 7H), 2.01 (m, 1H), 1.70 (m, 1H), 1.48-1.28 (m, 3H), 1.05-0.88 (m, 9H)。

10

実施例44(5)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-シクロヘキシルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

15

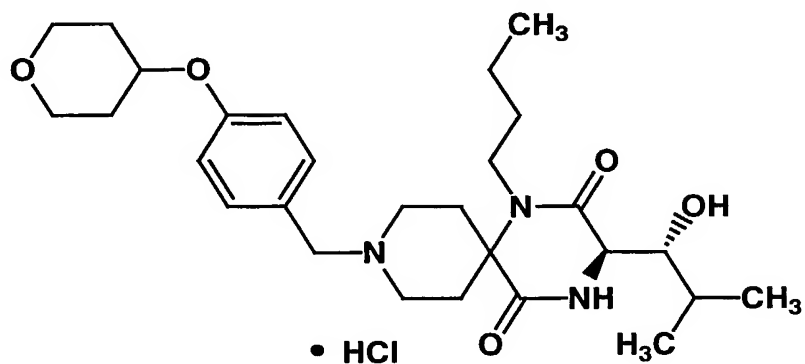


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.37 (m, 1H), 4.24 (brs, 2H), 4.13 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 3.94 (m, 1H), 3.68 (m, 1H), 3.52-3.34 (m, 2H), 3.29-3.07 (m, 3H), 2.52-1.92 (m, 7H), 1.85-1.27 (m, 12H), 1.04-0.89 (m, 9H)。

実施例 44 (6)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.20 (酢酸エチル : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.45 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.67-4.59

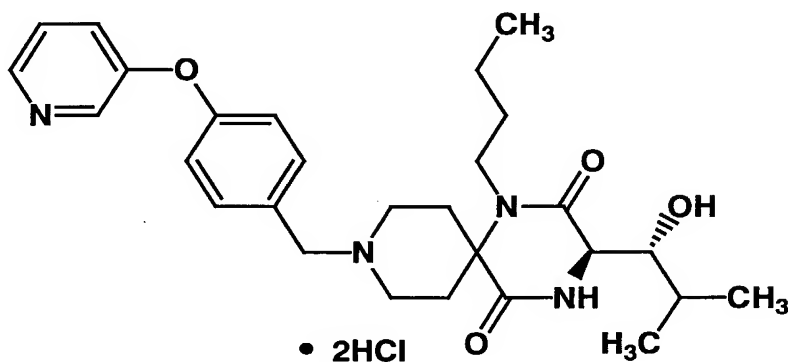
(m, 1H), 4.28 (s, 2H), 4.13 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.00-3.90 (m, 3H), 3.75-3.67 (m, 1H), 3.63-3.53 (m, 2H), 3.50-3.41 (m, 3H), 3.18 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.18 (m, 1H), 2.49-1.96 (m, 7H), 1.77-1.65 (m, 3H), 1.44-1.30 (m, 3H), 0.98 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5

実施例 4 4 (7)

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (ピリジン - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン - 2 塩

10 酸塩

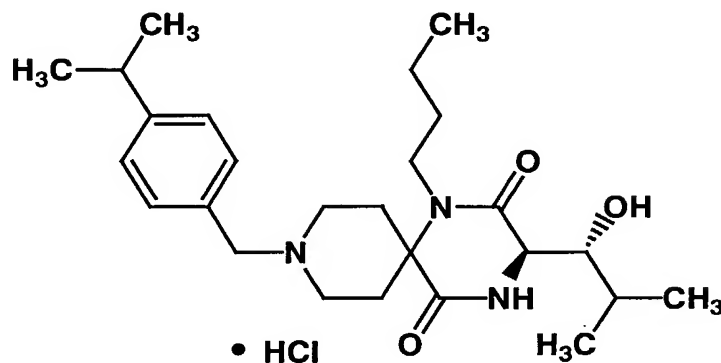


TLC : R_f 0.22 (酢酸エチル : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.76 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 8.29 (dd, J = 9.0, 2.5 Hz, 1H), 8.08 (dd, J = 9.0, 6.0 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.35 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.41 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.76 (m, 1H), 3.61-3.47 (m, 3H), 3.20 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 3.20 (m, 1H), 2.62 (m, 1H), 2.46 (m, 2H), 2.10 (m, 1H), 2.05-1.95 (m, 1H), 1.69 (m, 1H), 1.41-1.35 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

20 実施例 4 4 (8)

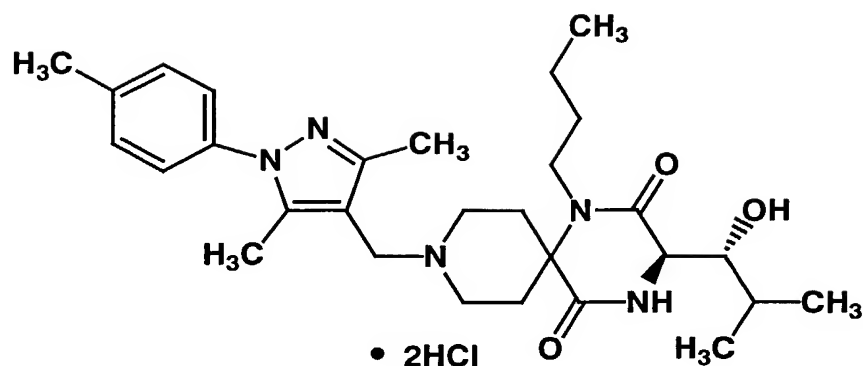
(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-イソプロピルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



- 5 TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.37 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.13 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.05-3.91 (m, 1H), 3.80-3.65 (m, 1H), 3.57-3.38 (m, 3H), 3.26-3.13 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 3.03-2.86 (m, 1H), 2.53-2.38 (m, 2H), 2.38-2.23 (m, 1H), 2.16-2.05 (m, 1H), 2.06-1.92 (m, 1H), 1.77-1.56
 10 (m, 1H), 1.49-1.26 (m, 3H), 1.25 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 44 (9)

- (3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-メチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

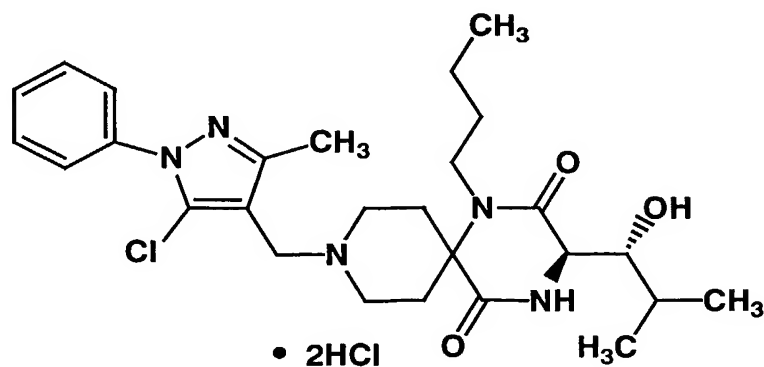


TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40 (s, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.15 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.11-3.97 (m, 1H), 3.86-3.72 (m, 1H), 3.64-3.50 (m, 3H), 3.39-3.30 (m, 1H), 3.21 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.72-2.55 (m, 1H), 2.53-2.40 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.18-2.07 (m, 1H), 2.07-1.96 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50-1.30 (m, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

10 実施例 44 (10)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3-メチル-5-クロロ-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

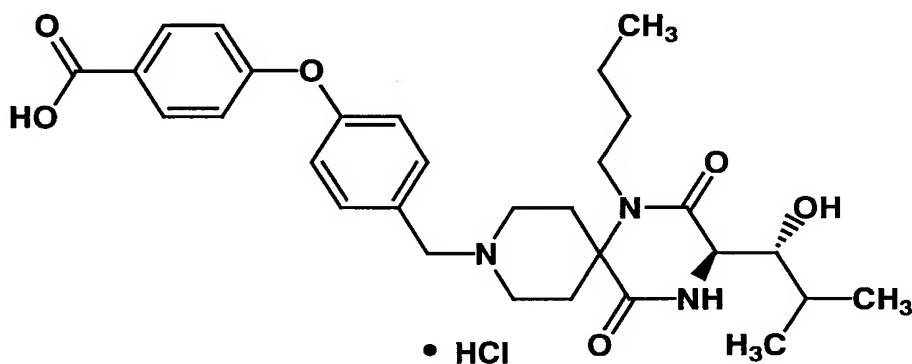


TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.58-7.47 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.15 (d, J = 2.1 Hz, 1H),
 4.15-4.02 (m, 1H), 3.89-3.75 (m, 1H), 3.65-3.48 (m, 3H), 3.30-3.20 (m, 1H), 3.20
 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.64-2.46 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.44-2.32 (m, 1H),
 5 2.21-2.10 (m, 1H), 2.08-1.93 (m, 1H), 1.80-1.60 (m, 1H), 1.52-1.30 (m, 3H), 0.99
 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 44 (11)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロ
 10 キシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-カルボキシフェニルオキシ)
 フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩
 酸塩

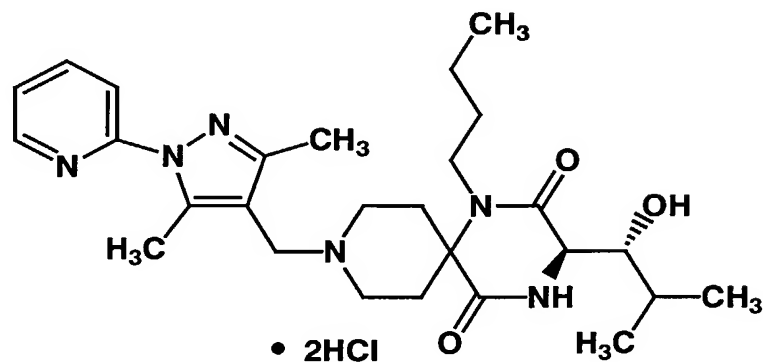


TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

15 NMR (CD₃OD) : δ 8.04 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.18 (d, J
 = 8.7 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H),
 4.10-3.94 (m, 1H), 3.83-3.69 (m, 1H), 3.59-3.40 (m, 3H), 3.25-3.12 (m, 1H), 3.19
 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.55-2.37 (m, 2H), 2.37-2.22 (m, 1H), 2.19-2.08 (m,
 1H), 2.08-1.94 (m, 1H), 1.79-1.60 (m, 1H), 1.52-1.26 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz,
 20 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 4 4 (1 2)

(3 R *) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R *) - 1 - ヒドロ
キシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3 , 5 - ジメチル - 1 - (ピリジン -
5 2 - イル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5 .
5] ウンデカン ・ 2 塩酸塩



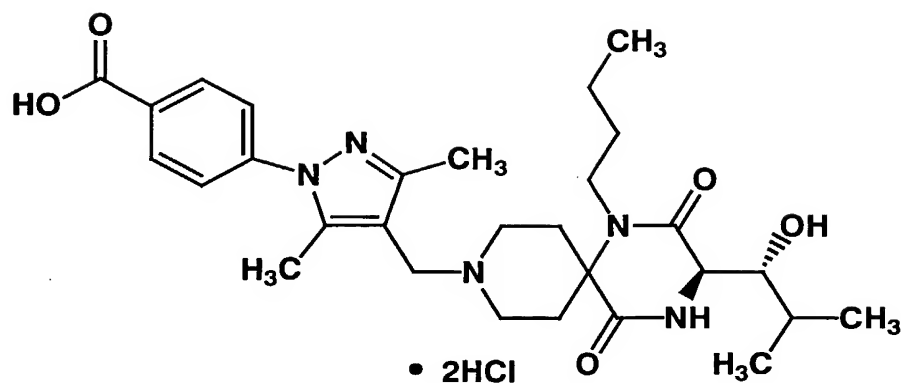
T L C : R f 0.28 (クロロホルム : メタノール = 1 0 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.53 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.05 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.81 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 7.8, 5.1 Hz, 1H), 4.33 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.06 (m, 1H), 3.78 (m, 1H), 3.62-3.44 (m, 3H), 3.26 (m, 1H), 3.21 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.68 (s, 3H), 2.60-2.30 (m, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.16 (m, 1H), 2.02 (m, 1H), 1.72 (m, 1H), 1.50-1.26 (m, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

15

実施例 4 4 (1 3)

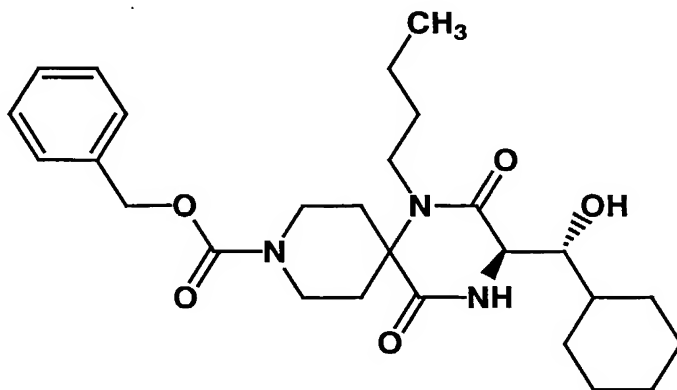
(3 R *) - 1 - ブチル - 2 , 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R *) - 1 - ヒドロ
キシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3 , 5 - ジメチル - 1 - (4 - カルボ
キシフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1 , 4 , 9 - トリアザスピ
20 ロ [5 . 5] ウンデカン ・ 2 塩酸塩



TLC : R_f 0.25 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 2 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 8.19 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.62 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.12-3.98 (m, 1H), 3.87-3.74 (m, 1H), 3.63-3.45 (m, 3H), 3.30-3.10 (m, 1H), 3.20 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.59-2.48 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.40-2.23 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.23-2.10 (m, 1H), 2.10-1.96 (m, 1H), 1.80-1.62 (m, 1H), 1.52-1.24 (m, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

10 実施例 4 5

(3R*) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル) - 9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

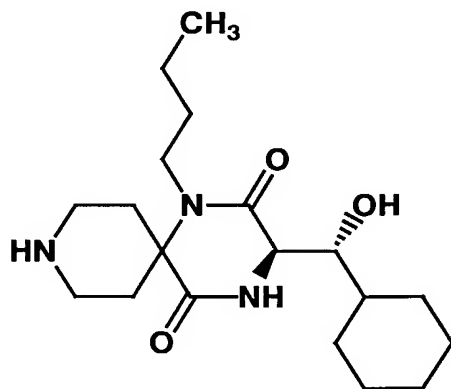


N-(t-ブチルオキシカルボニル)-L-ロイシンの代わりに、(2R*, 3R*)-N-(t-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-3-シクロヘキシルプロパン酸を用いて、実施例35と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

- 5 TLC : R_f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.39-7.27 (m, 5H), 5.13 (m, 2H), 4.13 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.06-4.02 (m, 2H), 3.78-3.48 (m, 2H), 3.36-3.29 (m, 2H), 3.02 (br, 1H), 2.17 (m, 1H), 2.03-1.58 (m, 10H), 1.47-1.13 (m, 6H), 1.02-0.89 (m, 5H)。

10 実施例 4 6

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



- 15 実施例45で製造した化合物を用いて、実施例9と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

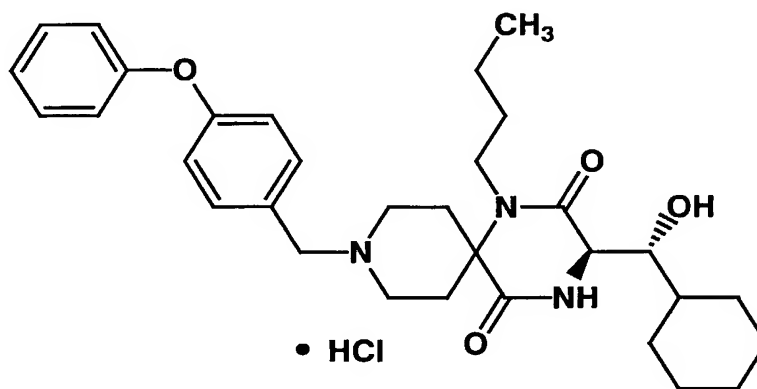
TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 6 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 4.13 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 3.48-3.22 (m, 5H), 2.97-2.89 (m, 2H), 2.12-1.65 (m, 10H), 1.56-1.16 (m, 7H), 1.03-0.85 (m, 5H)。

実施例 47 (1) ~ 47 (8)

実施例 46 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

5 実施例 47 (1)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

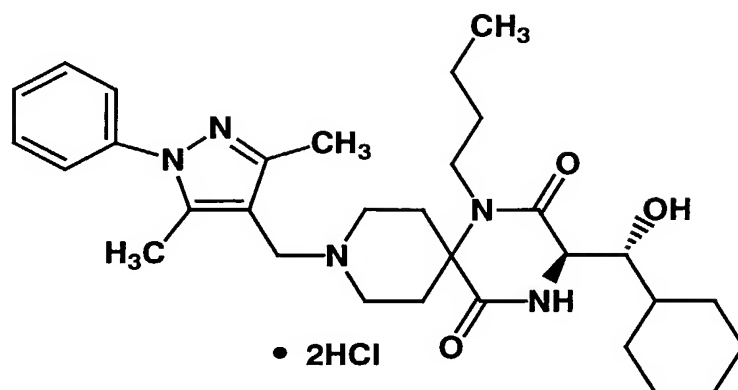


- 10 TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.55-7.51 (m, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.18 (tt, J = 7.5, 1.0 Hz, 1H), 7.08-7.01 (m, 4H), 4.32 (s, 2H), 4.15 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.98 (dt, J = 3.5, 12.5 Hz, 1H), 3.73 (dt, J = 3.5, 12.5 Hz, 1H), 3.57-3.39 (m, 3H), 3.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.20 (m, 1H), 2.52-2.39 (m, 2H), 2.30 (m, 1H), 2.12 (d, J = 15.5 Hz, 1H), 2.04-1.92 (m, 2H), 1.80-1.62 (m, 5H), 1.48-1.11 (m, 6H), 1.01-0.82 (m, 5H)。
 15 H)。

実施例 47 (2)

- (3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニ
- 20

ルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]
ウンデカン・2塩酸塩

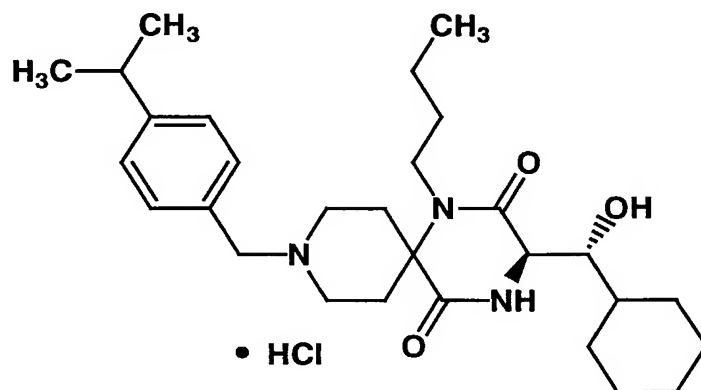


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.50 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.17 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.04 (m, 1H), 3.85-3.75 (m, 1H), 3.61-3.51 (m, 3H), 3.35-3.27 (m, 2H), 2.62 (m, 1H), 2.49-2.44 (m, 5H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (m, 1H), 2.05-1.92 (m, 2H), 1.77-1.65 (m, 5H), 1.44-1.15 (m, 6H), 1.01-0.85 (m, 5H)。

10 実施例 47 (3)

(3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-イソプロピルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

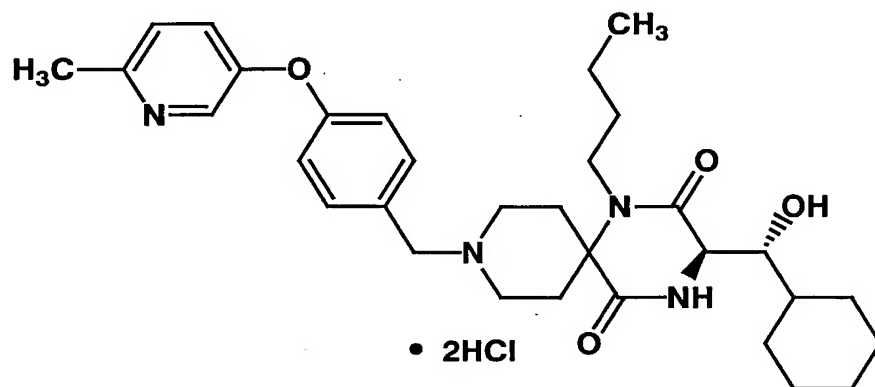


TLC : R_f 0.69 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 3.98 (m, 1H), 3.72 (m, 1H), 3.55-3.40 (m, 3H), 3.29-3.16 (m, 2H), 2.95 (m, 1H), 2.52-2.24 (m, 3H), 2.15-1.86 (m, 3H), 1.80-1.60 (m, 5H), 1.48-1.10 (m, 6H), 1.25 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 1.02-0.82 (m, 5H)。

実施例 47 (4)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-(6-メチルピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩

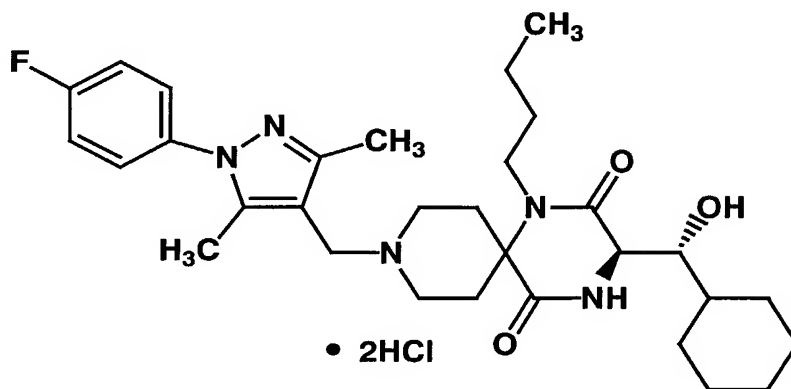


TLC : R_f 0.51 (酢酸エチル : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.59 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.19 (dd, J = 9.0, 2.7 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.39 (s, 2H), 4.15 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.99 (m, 1H), 3.73 (m, 1H), 3.61-3.46 (m, 3H), 3.37-3.26 (m, 2H), 2.77 (s, 3H), 2.62 (m, 1H), 2.45 (m, 1H), 2.13-1.92 (m, 3H), 1.73 (m, 4H), 1.40-1.14 (m, 8H), 1.01-0.86 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

20 実施例 47 (5)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(3,5-ジメチル-1-(4-フルオロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



5

TLC: R_f 0.49 (酢酸エチル:メタノール=10:1);

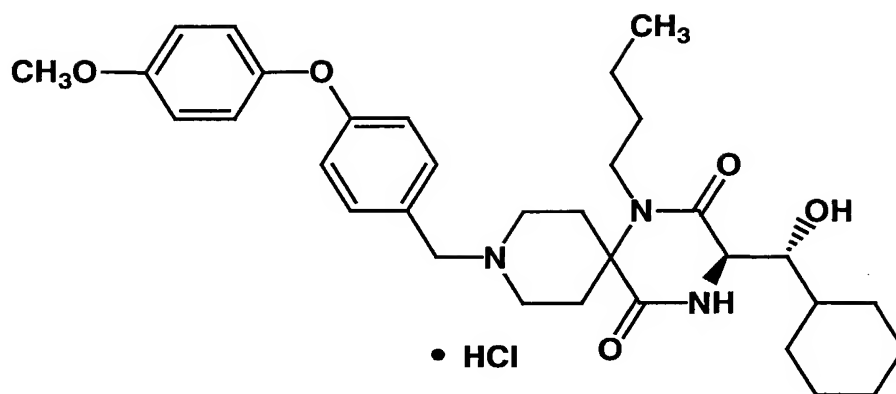
NMR (CD₃OD): δ 7.57 (m, 2H), 7.37-7.31 (m, 2H), 4.32 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.08-4.00 (m, 1H), 3.79 (m, 1H), 3.63-3.52 (m, 3H), 3.37-3.27 (m, 2H), 2.65 (m, 1H), 2.48 (m, 1H), 2.45 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.16-1.92 (m, 3H),

10 1.73 (m, 4H), 1.42-1.15 (m, 8H), 1.01-0.88 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例47(6)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-(4-メトキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

15

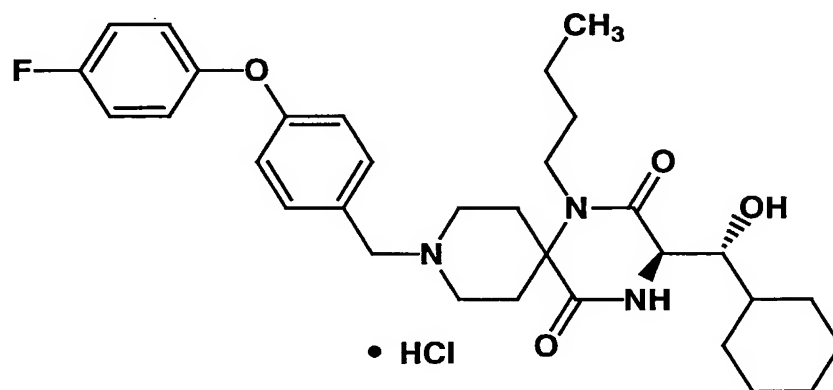


TLC : R_f 0.25 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.99-6.92 (m, 4H), 4.30 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 3.98 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.72 (m, 1H), 3.58-3.38 (m, 3H), 3.30-3.08 (m, 2H), 2.54-1.88 (m, 6H), 1.82-1.60 (m, 5H), 1.50-1.10 (m, 6H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 47 (7)

(3R*)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-(4-フルオロフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

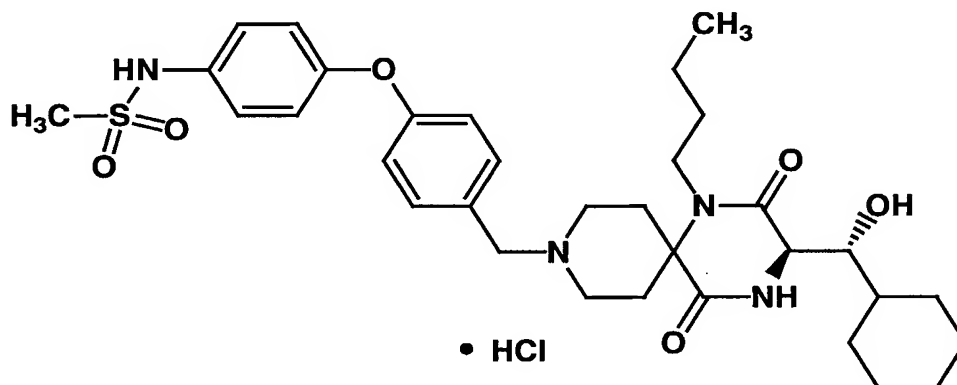
NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.10 - 7.04 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.72 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 3H), 3.30-3.08 (m, 2H), 2.56-1.88 (m, 6H), 1.82-1.60 (m, 5H), 1.54-1.10 (m, 6H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

5

実施例 47 (8)

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.

10 5] ウンデカン・塩酸塩



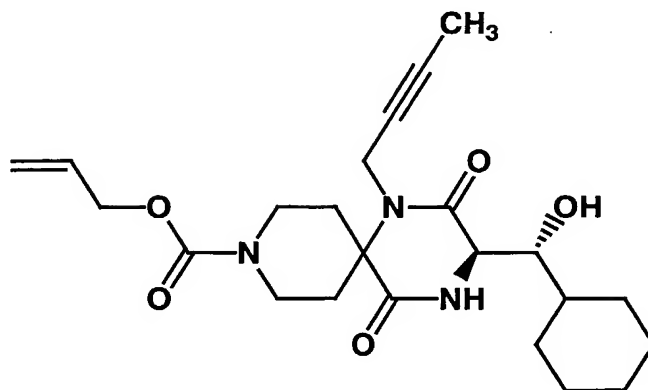
TLC : R_f 0.52 (酢酸エチル : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.30 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.34 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.76 (m, 1H), 3.58-3.42 (m, 3H), 3.30-3.08 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 2.54-1.88 (m, 6H), 1.82-1.62 (m, 5H), 1.50-1.14 (m, 6H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.96 (m, 2H)。

実施例 48

20 (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) -

1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-アリルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン



参考例 2 で製造した樹脂 (3)、N-アリルオキシカルボニル-4-ピペ
 5 リドン、2-ブチニルアミン、(2R*, 3R*)-N-(t-ブチルオキシ
 カルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-3-シクロヘキシルプロパン
 酸を用いて、参考例 3→参考例 6→実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性
 値を有する本発明化合物を得た。

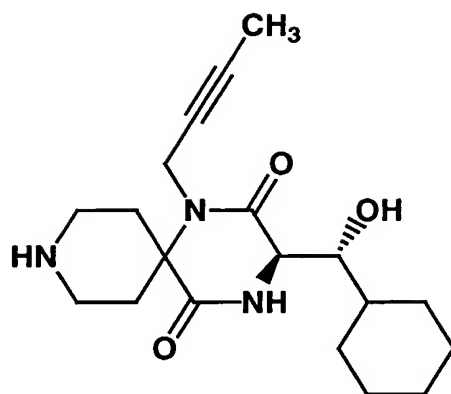
TLC: Rf 0.32 (クロロホルム: メタノール=15:1) ;

10 NMR (CD₃OD) : δ 6.04-5.91 (m, 1H), 5.35-5.27 (m, 1H), 5.23-5.19 (m, 1H),
 4.60-4.58 (m, 2H), 4.27 (dq, J = 17.5, 2.5 Hz, 1H), 4.19 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.07-
 4.01 (m, 2H), 3.89 (dq, J = 17.5, 2.5 Hz, 1H), 3.75-3.50 (m, 2H), 3.38 (dd, J = 9.0,
 2.5 Hz, 1H), 2.32-2.17 (m, 2H), 2.07-1.70 (m, 11H), 1.33-1.14 (m, 3H), 1.00-0.85
 (m, 2H)。

15

実施例 49

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピ
 ロ[5. 5]ウンデカン



実施例 48 で製造した化合物を用いて、参考例 4 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 6 : 1) ;

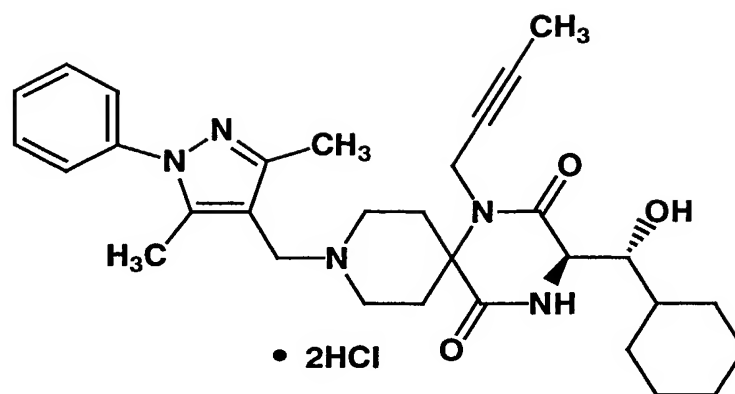
- 5 NMR (CD₃OD) : δ 4.28 (dq, J = 17.5, 2.5 Hz, 1H), 4.18 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.03 (dq, J = 17.5, 2.5 Hz, 1H), 3.48-3.29 (m, 3H), 2.99-2.90 (m, 2H), 2.26-1.73 (m, 14H), 1.32-1.18 (m, 3H), 1.01-0.91 (m, 2H)。

実施例 50 (1) ~ 50 (6)

- 10 実施例 49 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 10 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 50 (1)

- 15 (3R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - ((1R*) - 1-ヒドロキシ - 1-シクロヘキシルメチル) - 9 - (3, 5-ジメチル - 1-フェニルピラゾール - 4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

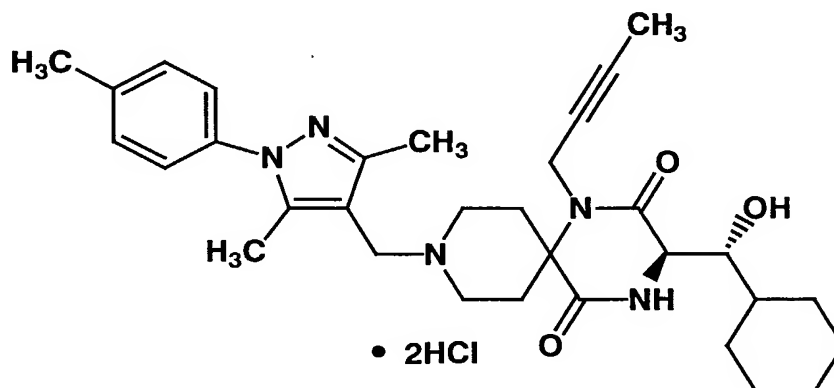


TLC : R_f 0.37 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.60-7.50 (m, 5H), 4.42-4.33 (m, 3H), 4.21 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 4.08-3.99 (m, 2H), 3.85-3.75 (m, 1H), 3.65-3.57 (m, 2H), 3.32 (m, 1H), 2.79 (m, 1H), 2.48-2.43 (m, 5H), 2.40 (s, 3H), 2.22 (m, 1H), 2.05-1.93 (m, 2H), 1.80-1.64 (m, 7H), 1.39-1.11 (m, 3H), 1.03-0.84 (m, 2H)。

実施例 50 (2)

(3R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - ((1R*) - 1-ヒドロキシー - 1-シクロヘキシルメチル) - 9 - (3, 5-ジメチルー 1 - (4-メチルフェニル) ピラゾール - 4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

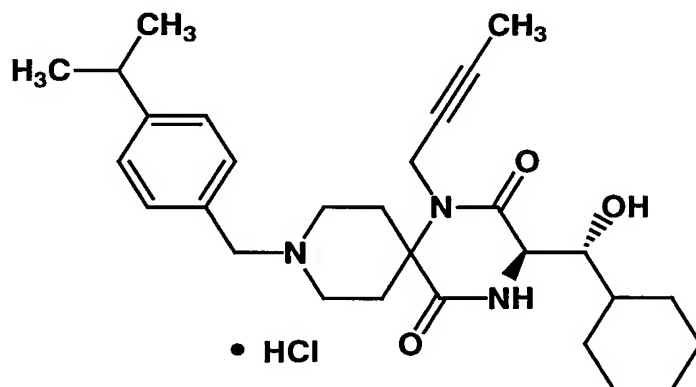
NMR (CD₃OD) : δ 7.40 (s, 4H), 4.45-4.30 (m, 3H), 4.20 (m, 1H), 4.16-3.98 (m, 2H), 3.78 (m, 1H), 3.68-3.56 (m, 2H), 3.30 (m, 1H), 2.82 (m, 1H), 2.56-2.42 (m, 8H), 2.39 (s, 3H), 2.28-1.88 (m, 3H), 1.80-1.60 (m, 7H), 1.40-1.10 (m, 3H), 1.12-0.82 (m, 2H)。

5

実施例 50 (3)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-イソプロピルフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸

10 塩



TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.38-4.28 (m, 3H), 4.17 (m, 1H), 4.04-3.88 (m, 2H), 3.74 (m, 1H), 3.50-3.40 (m, 2H), 3.28 (m, 1H), 2.92 (m, 1H), 2.64 (m, 1H), 2.50-1.86 (m, 5H), 1.80-1.62 (m, 7H), 1.36-1.04 (m, 3H), 1.25 (d, J = 7.2 Hz, 6H), 1.00-0.82 (m, 2H)。

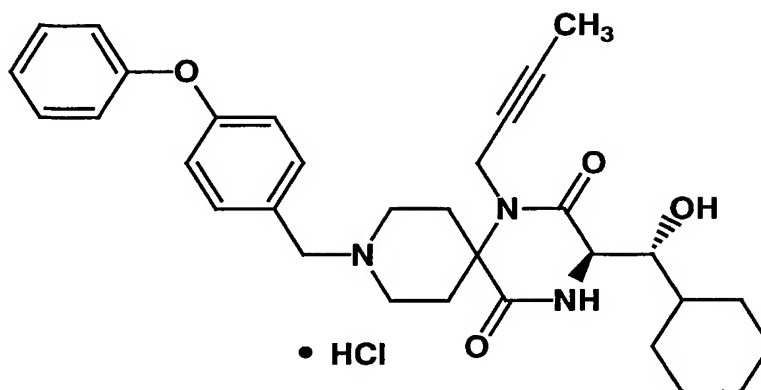
15

実施例 50 (4)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-フェニルオキシ

20

フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

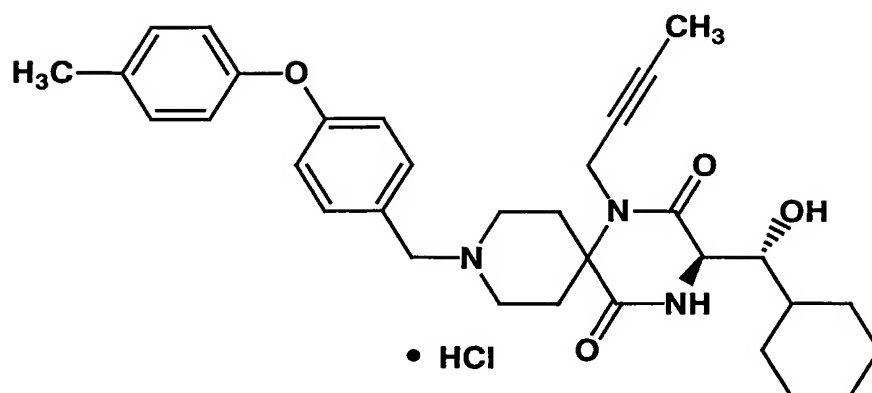


TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.42-7.37 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.06-7.02 (m, 4H), 4.40-4.30 (m, 3H), 4.18 (m, 1H), 4.04-3.90 (m, 2H), 3.72 (m, 1H), 3.30-3.20 (m, 2H), 3.28 (m, 1H), 2.68 (m, 1H), 2.52-1.86 (m, 5H), 1.80-1.60 (m, 7H), 1.38-1.10 (m, 3H), 1.02-0.82 (m, 2H)。

10 実施例 50 (5)

(3R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3 - ((1R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - (4-メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5 : 5] ウンデカン・塩酸塩

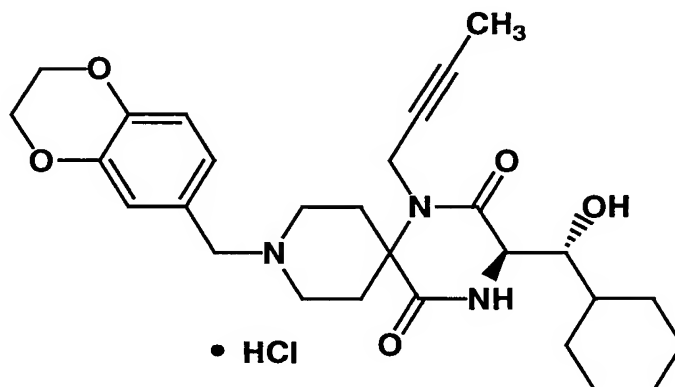


TLC : R f 0.45 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.20 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40-4.28 (m, 3H), 4.18 (m, 1H), 4.04-3.88 (m, 2H), 3.74 (m, 1H), 3.52-3.40 (m, 2H), 3.26 (m, 1H), 2.64 (m, 1H), 2.54-1.86 (m, 5H), 2.33 (s, 3H), 1.80-1.62 (m, 7H), 1.38-1.10 (m, 3H), 1.02-0.82 (m, 2H)。

实施例 50 (6)

- 10 (3 R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ-3-((1 R*) - 1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル) - 9 - (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

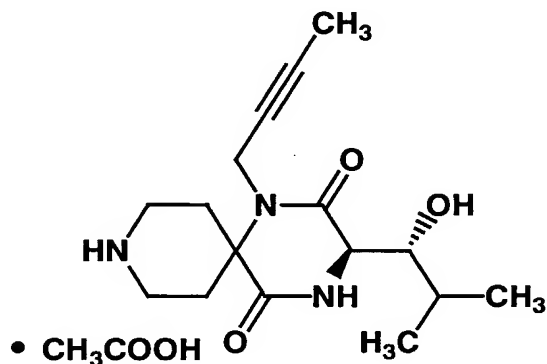


TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (s, 1H), 6.99-6.91 (m, 2H), 4.35 (m, 1H), 4.27 (s, 4H), 4.24 (s, 2H), 4.18 (m, 1H), 4.04-3.84 (m, 2H), 3.70 (m, 1H), 3.56-3.38 (m, 2H), 3.28 (m, 1H), 2.68-1.88 (m, 6H), 1.80-1.60 (m, 7H), 1.40-1.10 (m, 3H), 1.02-0.80 (m, 2H)。

実施例 5 1

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・酢酸塩



(2R*, 3R*)-N-(*t*-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-3-シクロヘキシルプロパン酸の代わりに、(2R*, 3R*)-N-(*t*-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メチルペンタン酸を用いて、実施例 4 8 → 実施例 4 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.22 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 20 : 6 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.36 (dq, J = 17.0, 2.5 Hz, 1H), 4.19 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.95-3.79 (m, 2H), 3.62 (dt, J = 3.5, 13.0 Hz, 1H), 3.34-3.26 (m, 2H), 3.22 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 2.54-2.43 (m, 1H), 2.37 (m, 1H), 2.20-1.98 (m, 3H), 1.91 (s,

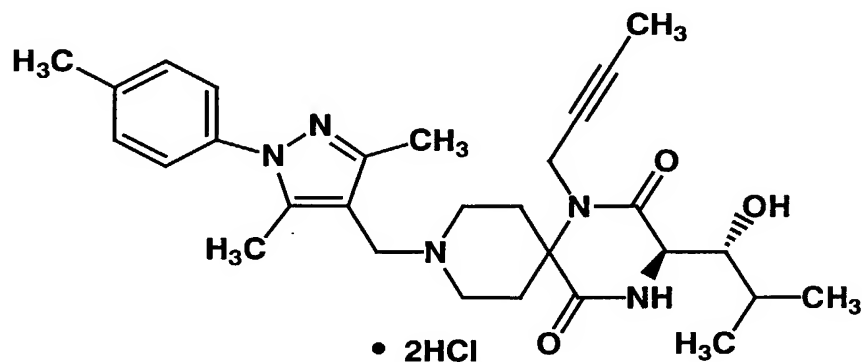
3H), 1.75 (t, J = 2.5 Hz, 3H), 1.01-0.97 (m, 6H)。

実施例 5 2 (1) ~ 5 2 (5)

実施例 5 1 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施
5 例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 5 2 (1)

(3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) -
1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4
10 - メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザ
スピロ [5. 5] ウンデカン・2 塩酸塩

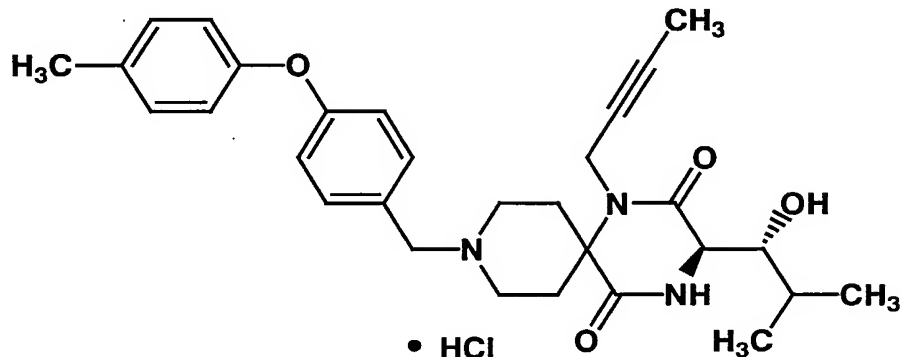


TLC : R_f 0.28 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.38 (d, J = 3.9 Hz, 2H), 7.35 (d, J = 3.9 Hz, 2H), 4.33 (s,
15 2H), 4.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.10-3.90 (m, 2H), 3.78 (m, 1H), 3.68-3.52 (m, 2H),
3.22 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.74 (m, 1H), 2.54-2.20 (m, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.40
(s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.98 (m, 1H), 1.75 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz,
3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

20 実施例 5 2 (2)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



5

TLC: R_f 0.26 (クロロホルム:メタノール=10:1);

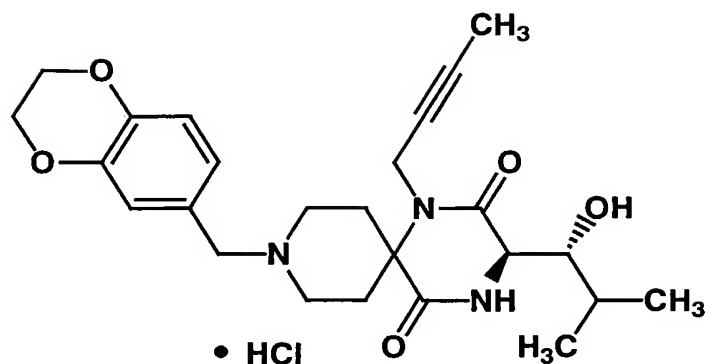
NMR (CD₃OD): δ 7.49 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.21 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.93 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 4.40 (m, 1H), 4.34 (s, 2H), 4.19 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.08-3.82 (m, 2H), 3.76 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 2H), 3.20 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.72-2.42 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.35-2.18 (m, 2H), 2.00 (m, 1H), 1.74 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

10

実施例 5 2 (3)

(3R*)-1-(2-ブチニル)-2,5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

15

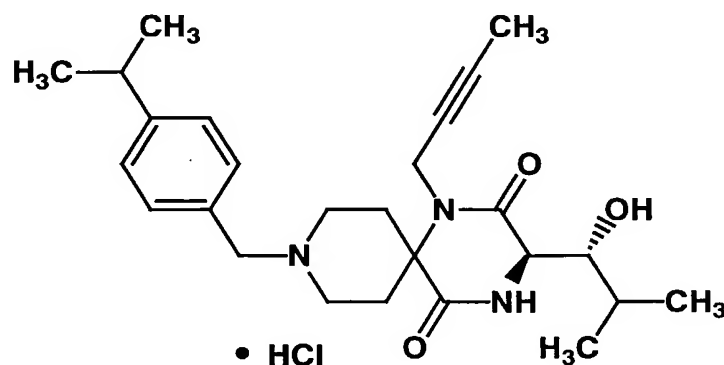


TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.06-6.92 (m, 3H), 4.38 (m, 1H), 4.28 (s, 4H), 4.25 (s, 2H),
 4.19 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.02-3.84 (m, 2H), 3.70 (m, 1H), 3.52-3.36 (m, 2H),
 5 3.20 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.60 (m, 1H), 2.48 (m, 1H), 2.32-2.16 (m, 2H),
 2.00 (m, 1H), 1.74 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz,
 3H)。

実施例 5 2 (4)

10 (3R*) - 1 - (2-ブチニル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - ((1R*) - 1-ヒドロキシ - 2-メチルプロピル) - 9 - (4-イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.29 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

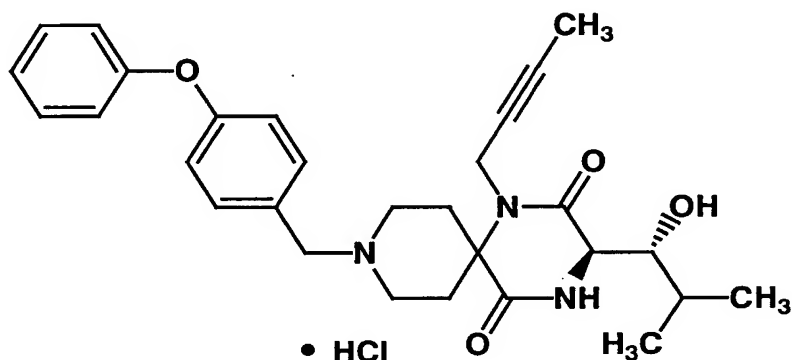
15 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 4.40 (m,

1H), 4.33 (s, 2H), 4.19 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.08-3.84 (m, 2H), 3.76 (m, 1H), 3.52-3.40 (m, 2H), 3.20 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.96 (m, 1H), 2.62 (m, 1H), 2.48 (m, 1H), 2.36-2.12 (m, 2H), 2.00 (m, 1H), 1.74 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.24 (d, J = 7.2 Hz, 6H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5

実施例 5 2 (5)

(3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : R_f 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.41 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 7.19 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.09-7.03 (m, 4H), 4.40 (m, 1H), 4.35 (s, 2H), 4.19 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.08-3.84 (m, 2H), 3.78 (m, 1H), 3.58-3.42 (m, 2H), 3.21 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.72-2.42 (m, 2H), 2.38-2.18 (m, 2H), 2.00 (m, 1H), 1.74 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

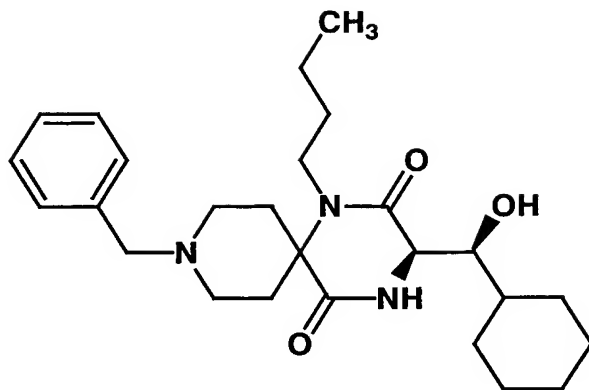
15

実施例 5 3

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - ベンジル - 1, 4, 9 - トリアザ

20

スピロ〔5.5〕ウンデカン



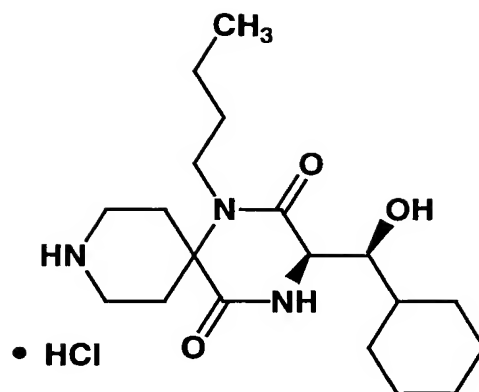
参考例 2 で製造した樹脂 (3)、N-ベンジル-4-ピペリドン、n-ブチルアミン、(2R*, 3S*)-N-(t-ブチルオキシカルボニル)-2-
 5 -アミノ-3-ヒドロキシ-3-シクロヘキシルプロパン酸を用いて、参考
 例 3 → 参考例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明
 化合物を得た。

TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.20 (m, 5H), 4.04 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.65-3.45 (m,
 10 2H), 3.57 (s, 2H), 3.30 (m, 1H), 3.05 (m, 1H), 2.86-2.77 (m, 3H), 2.30-2.00 (m,
 4H), 1.90-1.60 (m, 6H), 1.60-1.10 (m, 9H), 1.10-0.90 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz,
 3H)。

実施例 5 4

15 (3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1S*)-1-ヒドロ
 キシ-1-シクロヘキシルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ〔5.5〕
 ウンデカン・塩酸塩



実施例 5 3 で製造した化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 10 : 2 : 1) ;

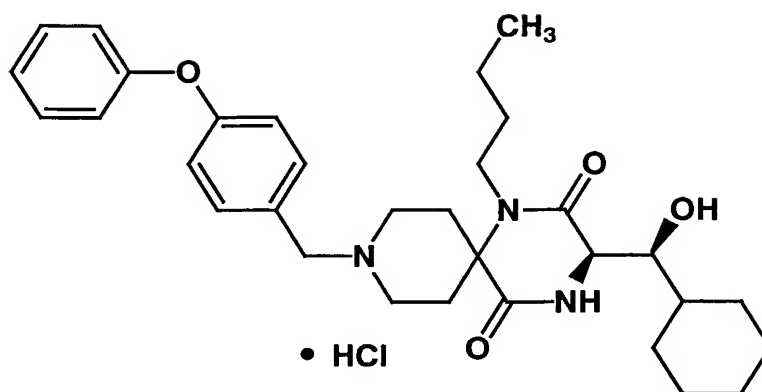
- 5 NMR (CD₃OD) : δ 4.08 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.70-3.12 (m, 7H), 2.50-2.02 (m, 5H), 1.85-1.66 (m, 5H), 1.55-1.10 (m, 7H), 1.10-0.85 (m, 2H), 0.97 (t, J = 6.9 Hz, 3H)。

実施例 5 5 (1) ~ 5 5 (3)

- 10 実施例 5 4 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 5 5 (1)

- 15 (3R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1S*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

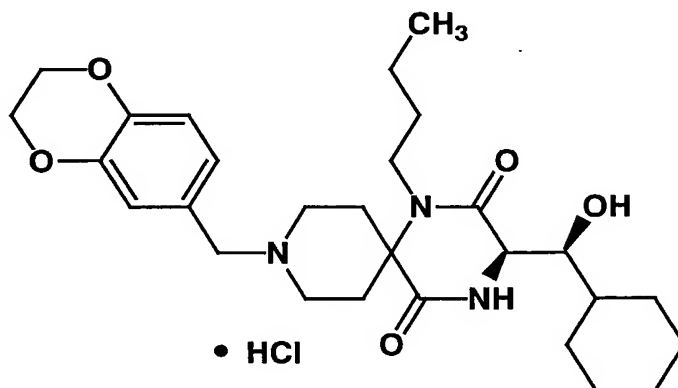


TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.09-7.00 (m, 4H), 4.30 (brs, 2H), 4.08 (d, J = 1.2 Hz, 1H),
 5 4.04 (m, 1H), 3.74-3.36 (m, 5H), 3.16 (m, 1H), 2.55-2.33 (m, 2H), 2.32-2.09 (m, 2H), 2.04 (m, 1H), 1.84-1.61 (m, 5H), 1.53-1.12 (m, 7H), 1.04-0.86 (m, 5H)。

実施例 55 (2)

(3R*)-1-(4-(1,3-ベンゾジオキサ-5-イルメチル)フェニル)-2,5-ジオキソ-3-(1S*)-1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(1,4-ペンゾジオキサ-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

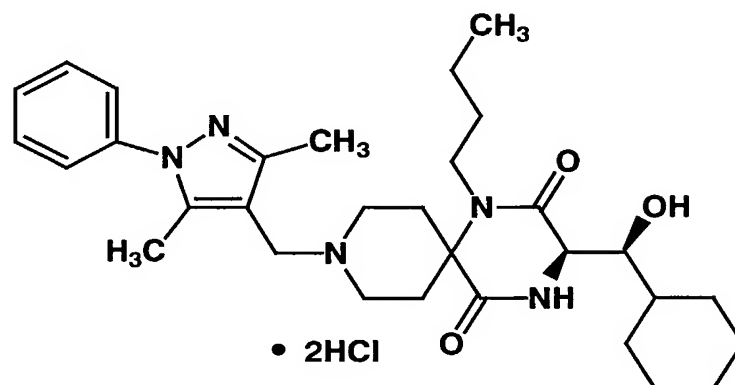
NMR (CD₃OD) : δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.21 (s, 2H), 4.07 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 4.01 (m, 1H), 3.70-3.34 (m, 5H), 3.16 (m, 1H), 2.53-2.32 (m, 2H), 2.31-2.08 (m, 2H), 2.03 (m, 1H), 1.84-1.60 (m, 5H), 1.52-1.12 (m, 7H), 1.04-0.85 (m, 5H)。

5

実施例 5 5 (3)

(3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]

10 ウンデカン・2 塩酸塩



TLC : R_f 0.31 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

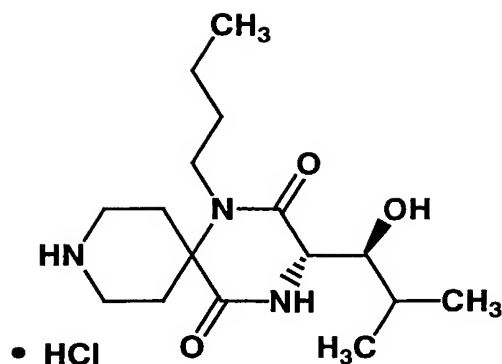
NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.44 (m, 5H), 4.31 (s, 2H), 4.19-4.06 (m, 2H), 3.73 (m, 1H), 3.66-3.52 (m, 4H), 3.26 (m, 1H), 2.62-2.48 (m, 2H), 2.45-2.30 (m, 7H), 2.19 (m, 1H), 2.04 (m, 1H), 1.84-1.63 (m, 5H), 1.54-1.12 (m, 7H), 1.05-0.86 (m, 5H)。

15

実施例 5 6

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデ

20 カン・塩酸塩



(2R*, 3R*)-N-(*t*-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メチルペンタン酸の代わりに、(2S, 3S)-N-(*t*-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メチルペンタン酸を用いて、実施例42→実施例43と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC: R_f 0.08 (クロロホルム: メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.15 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.96 (dt, J = 13.0, 4.0 Hz, 1H), 3.71 (dt, J = 13.0, 4.0 Hz, 1H), 3.57-3.47 (m, 1H), 3.40-3.34 (m, 2H), 3.23-3.12 (m, 2H), 2.47-2.30 (m, 2H), 2.25-1.98 (m, 3H), 1.79-1.66 (m, 1H), 1.52-1.28 (m, 3H), 1.07-0.94 (m, 9H) ;

比旋光度: [α]_D -13.8 (c 1.00, メタノール)。

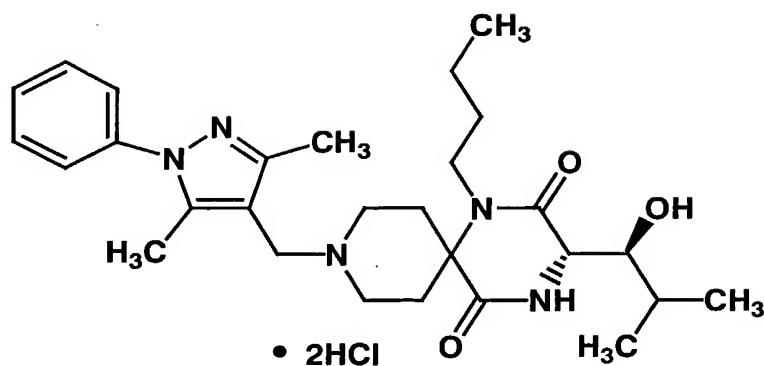
実施例57(1)～57(4)

実施例56で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例10と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例57(1)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカ

ン・2 塩酸塩

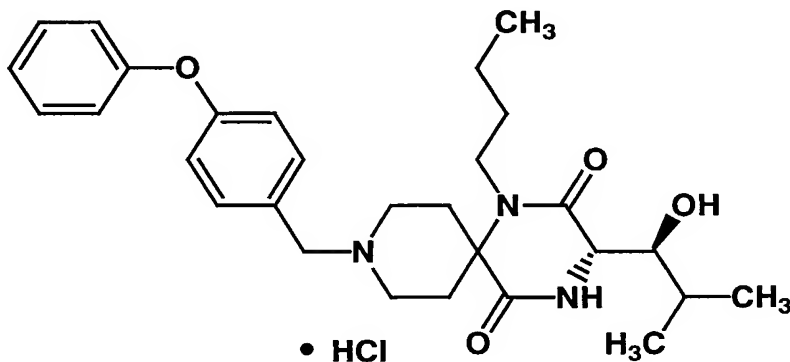


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.43 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H),
 5 4.12-3.99 (m, 1H), 3.90-3.72 (m, 1H), 3.64-3.44 (m, 3H), 3.30-3.12 (m, 1H), 3.20
 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.60-2.30 (m, 9H), 2.24-2.10 (m, 1H), 2.10-1.95 (m,
 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.54-1.30 (m, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J =
 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H)。

10 実施例 57 (2)

(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1S) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

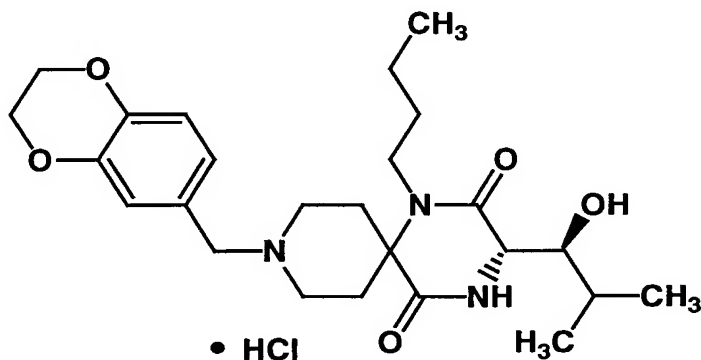


15 TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.36 (m, 2H), 7.21-7.14 (m, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.06-3.92 (m, 1H), 3.81-3.66 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 3H), 3.30-3.10 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.53-2.37 (m, 2H), 2.37-2.18 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 2.06-1.95 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50-1.26 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 57 (3)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

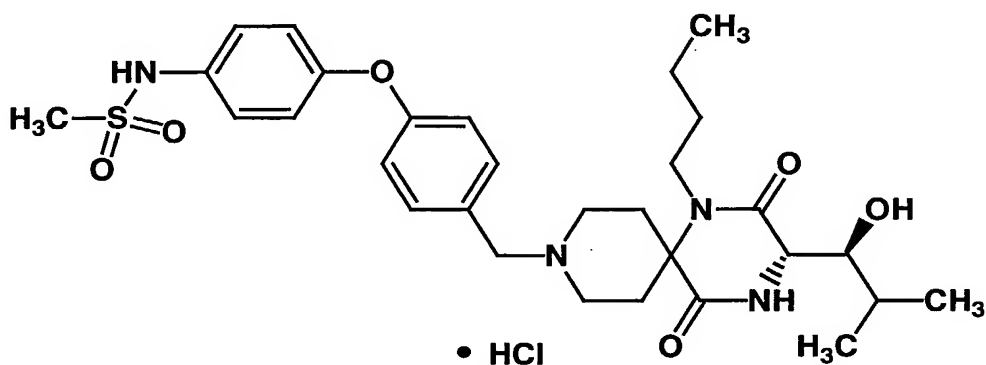


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.06 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.13 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 4.02-3.87 (m, 1H), 3.77-3.62 (m, 1H), 3.57-3.35 (m, 3H), 3.28-3.08 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.6, 2.4 Hz, 1H), 2.51-2.35 (m, 2H), 2.35-2.18 (m, 1H), 2.17-2.05 (m, 1H), 2.05-1.90 (m, 1H), 1.80-1.58 (m, 1H), 1.50-1.26 (m, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 5 7 (4)

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

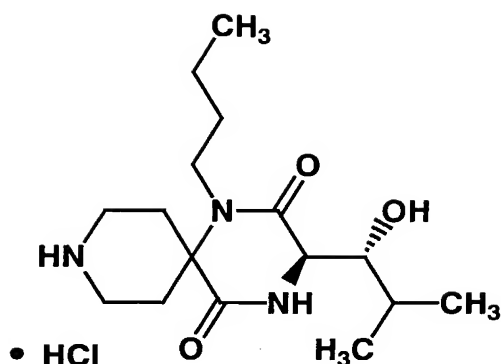


TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.06-3.92 (m, 1H), 3.81-3.66 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 3H), 3.25-3.10 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.95 (s, 3H), 2.54-2.37 (m, 2H), 2.37-2.22 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 2.08-1.92 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50-1.28 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

15 実施例 5 8

(3 R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



(2R*, 3R*)-N-(tert-butyloxycarbonyl)-2-amino-3-hydroxy-4-methylpentanoic acidの代わりに、(2R, 3R)-N-(tert-butyloxycarbonyl)-2-amino-3-hydroxy-4-methylpentanoic acidを用いて、実施例42→実施例43と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC: R_f 0.08 (クロロホルム: メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.15 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 3.96 (dt, J = 13.0, 4.0 Hz, 1H), 3.71 (dt, J = 13.0, 4.0 Hz, 1H), 3.57-3.47 (m, 1H), 3.40-3.34 (m, 2H), 3.23-3.12 (m, 2H), 2.47-2.30 (m, 2H), 2.25-1.98 (m, 3H), 1.79-1.66 (m, 1H), 1.52-1.28 (m, 3H), 1.07-0.94 (m, 9H) ;

比旋光度 : [α]_D +13.9 (c 1.00, メタノール) 。

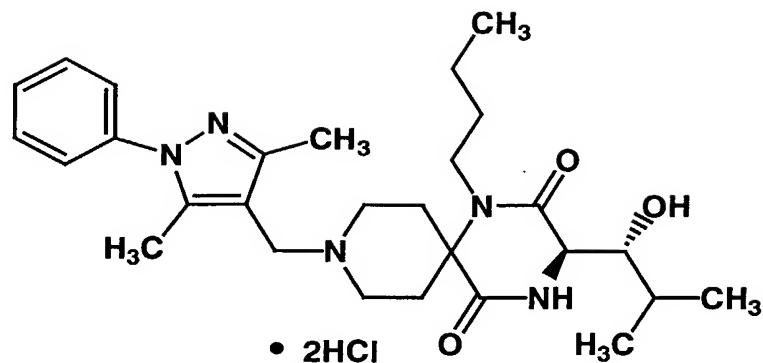
実施例59 (1) ~ 59 (4)

15 実施例58で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例10と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例59 (1)

20 (3R)-1-tert-butyl-2,5-dioxaspiro[3.3]undecan-9-one (3,5-dimethyl-1-phenylpyrazol-4-ylmethyl)-1,4,9-triazaspiro[5.5]undecan-9-one

ン・2 塩酸塩

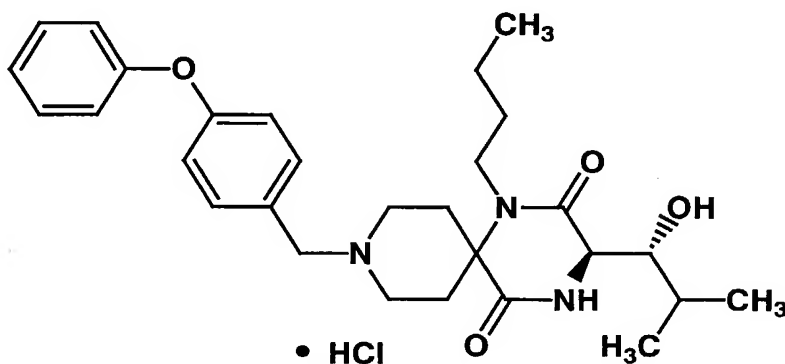


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.61-7.43 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H),
 5 4.12-3.99 (m, 1H), 3.90-3.72 (m, 1H), 3.64-3.44 (m, 3H), 3.30-3.12 (m, 1H), 3.20
 (dd, J = 9.3, 2.1 Hz, 1H), 2.60-2.30 (m, 9H), 2.24-2.10 (m, 1H), 2.10-1.95 (m,
 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.54-1.30 (m, 3H), 1.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.98 (d, J =
 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 6.9 Hz, 3H)。

10 実施例 59 (2)

(3R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

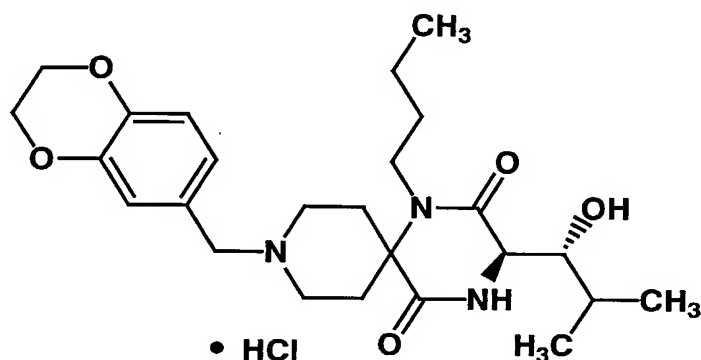


15 TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.43-7.36 (m, 2H), 7.21-7.14 (m, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.06-3.92 (m, 1H), 3.81-3.66 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 3H), 3.30-3.10 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.53-2.37 (m, 2H), 2.37-2.18 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 2.06-1.95 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50-1.26 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 59 (3)

(3R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

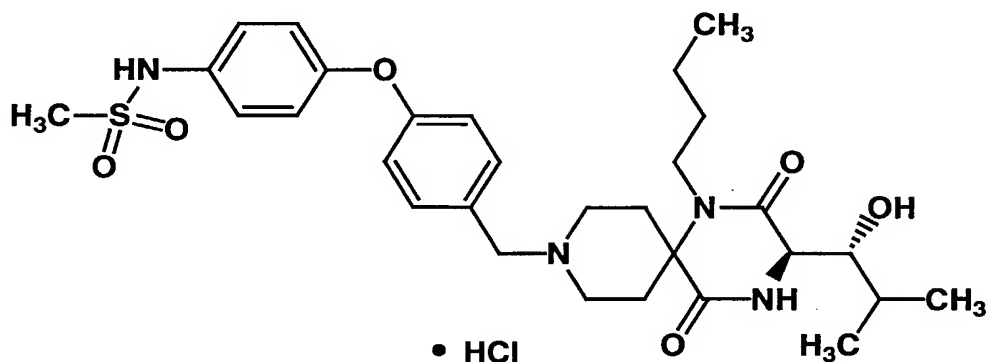


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.06 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.13 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 4.02-3.87 (m, 1H), 3.77-3.62 (m, 1H), 3.57-3.35 (m, 3H), 3.28-3.08 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.6, 2.4 Hz, 1H), 2.51-2.35 (m, 2H), 2.35-2.18 (m, 1H), 2.17-2.05 (m, 1H), 2.05-1.90 (m, 1H), 1.80-1.58 (m, 1H), 1.50-1.26 (m, 3H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 59 (4)

(3R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

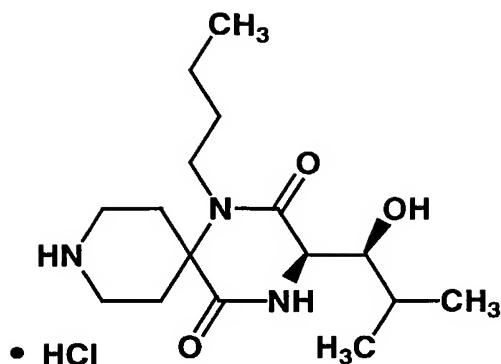


TLC : R_f 0.35 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.14 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.06-3.92 (m, 1H), 3.81-3.66 (m, 1H), 3.58-3.40 (m, 3H), 3.25-3.10 (m, 1H), 3.19 (dd, J = 9.6, 2.1 Hz, 1H), 2.95 (s, 3H), 2.54-2.37 (m, 2H), 2.37-2.22 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 2.08-1.92 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 1H), 1.50-1.28 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

15 実施例 60

(3R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1S) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



(2 R*, 3 S*) -N-(t-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-3-シクロヘキシルプロパン酸の代わりに、(2 R, 3 S) -N-(t-ブチルオキシカルボニル)-2-アミノ-3-ヒドロキシ-4-
5 -メチルペンタン酸を用いて、実施例 5 3 → 実施例 5 4 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

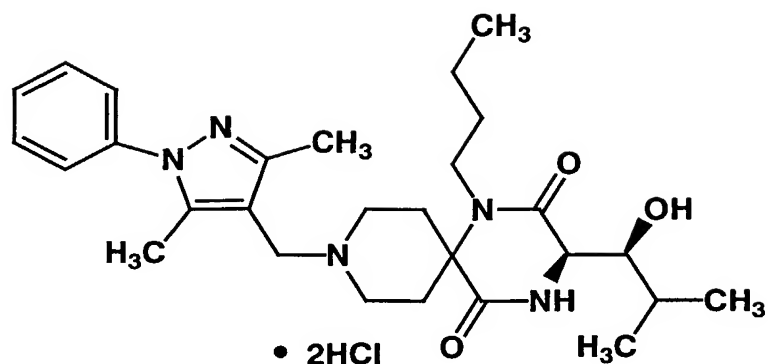
TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 10 : 2 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 4.08 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.02 (dt, J = 12.6, 3.9 Hz, 1H),
3.70-3.00 (m, 6H), 2.50-2.10 (m, 4H), 1.80-1.60 (m, 2H), 1.55-1.35 (m, 3H), 1.02
10 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.99 (t, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H) ;
比旋光度 : [α]_D +21.2 (c 1.00、メタノール)。

実施例 6 1 (1) ~ 6 1 (3)

実施例 6 0 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施
15 例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

実施例 6 1 (1)

(3 R) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S) -1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾ
20 ール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・2 塩酸塩

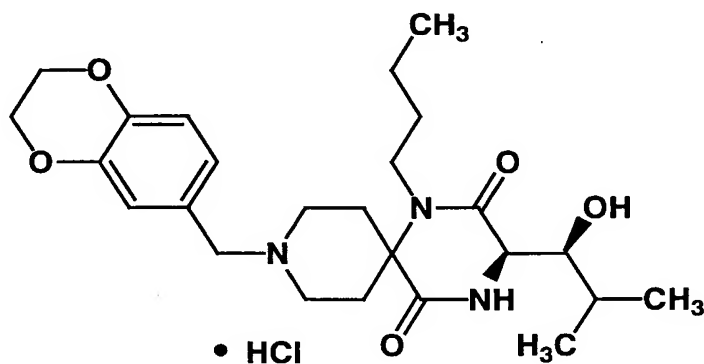


TLC : Rf 0.44 (クロロホルム：メタノール=10：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.64-7.46 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.19-4.06 (m, 1H), 4.10 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.80-3.53 (m, 4H), 3.51 (dd, J = 10.2, 1.5 Hz, 1H), 3.40-3.20 (m, 1H), 2.70-2.30 (m, 9H), 2.23-2.10 (m, 1H), 1.83-1.60 (m, 2H), 1.53-1.30 (m, 3H), 1.02 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

实施例 61 (2)

(3 R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - ヒドロキ
10 シ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメ
チル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



TLC : R_f 0.44 (クロロホルム：メタノール＝10：1)；

NMR (CD₃OD) : δ 7.06 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92
15 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.08 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.08-3.96

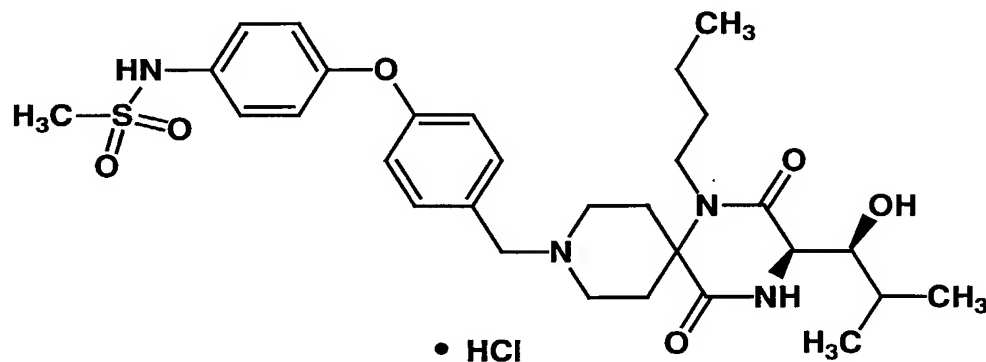
(m, 1H), 3.72-3.35 (m, 4H), 3.49 (dd, J = 10.2, 1.5 Hz, 1H), 3.28-3.08 (m, 1H), 2.55-2.35 (m, 2H), 2.35-2.18 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 1.82-1.62 (m, 2H), 1.52-1.25 (m, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

5

実施例 6 1 (3)

(3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

10

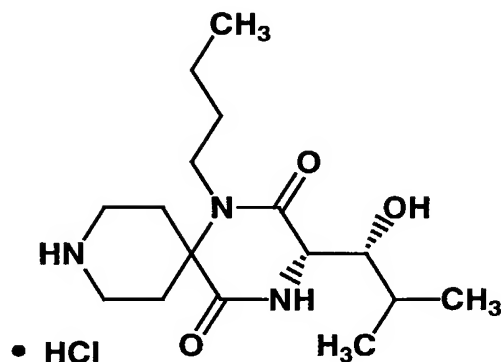


TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.03 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.13-4.00 (m, 1H), 4.09 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.75-3.62 (m, 1H), 3.62-3.39 (m, 3H), 3.49 (dd, J = 10.5, 1.5 Hz, 1H), 3.26-3.12 (m, 1H), 2.95 (s, 3H), 2.56-2.37 (m, 2H), 2.37-2.20 (m, 1H), 2.20-2.10 (m, 1H), 1.82-1.63 (m, 2H), 1.50-1.30 (m, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

20 実施例 6 2

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



- 5 (2 R*, 3 S*) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 3 - シクロヘキシルプロパン酸の代わりに、(2 S, 3 R) - N - (t - ブチルオキシカルボニル) - 2 - アミノ - 3 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン酸を用いて、実施例 5 3 → 実施例 5 4 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。
- 10 T L C : R f 0.51 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 1 0 : 2 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 4.08 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.02 (dt, J = 12.6, 3.9 Hz, 1H), 3.70-3.00 (m, 6H), 2.50-2.10 (m, 4H), 1.80-1.60 (m, 2H), 1.55-1.35 (m, 3H), 1.02 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.99 (t, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H) ;
比旋光度 : $[\alpha]_D -23.4$ (c 1.00, メタノール) 。

15

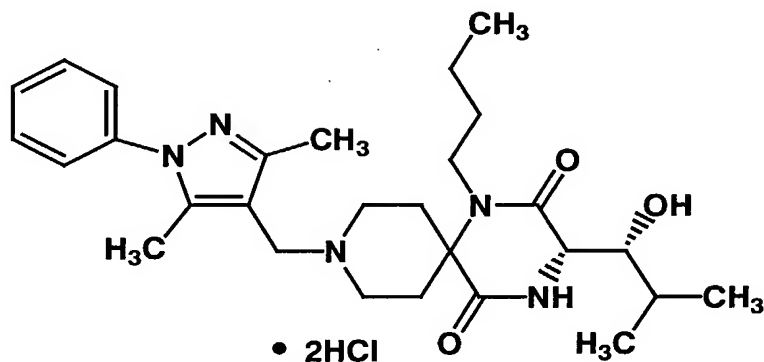
実施例 6 3 (1) ~ 6 3 (3)

実施例 6 2 で製造した化合物と相当するアルデヒド化合物を用いて、実施例 1 0 と同様の操作をし、以下に示した本発明化合物を得た。

20

実施例 6 3 (1)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・2塩酸塩



5

TLC: R_f 0.44 (クロロホルム:メタノール=10:1);

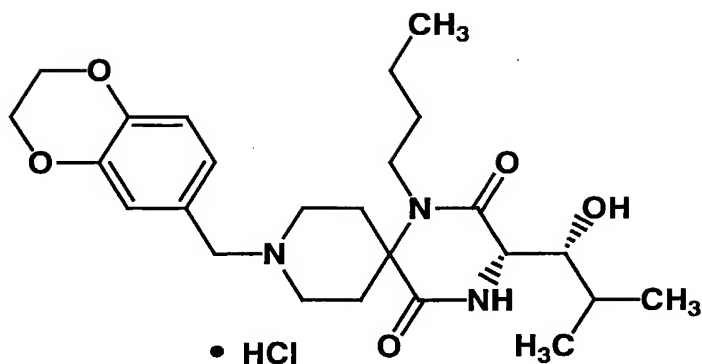
NMR (CD₃OD): δ 7.64-7.46 (m, 5H), 4.32 (s, 2H), 4.19-4.06 (m, 1H), 4.10 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.80-3.53 (m, 4H), 3.51 (dd, J = 10.2, 1.5 Hz, 1H), 3.40-3.20 (m, 1H), 2.70-2.30 (m, 9H), 2.23-2.10 (m, 1H), 1.83-1.60 (m, 2H), 1.53-1.30 (m, 3H),

10 1.02 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 63 (2)

(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

15

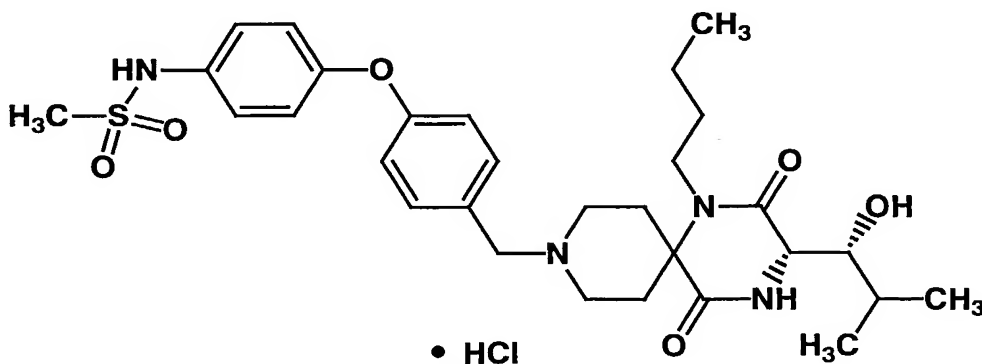


TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.06 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.08 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.08-3.96 (m, 1H), 3.72-3.35 (m, 4H), 3.49 (dd, J = 10.2, 1.5 Hz, 1H), 3.28-3.08 (m, 1H), 2.55-2.35 (m, 2H), 2.35-2.18 (m, 1H), 2.18-2.08 (m, 1H), 1.82-1.62 (m, 2H), 1.52-1.25 (m, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

10 実施例 6 3 (3)

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

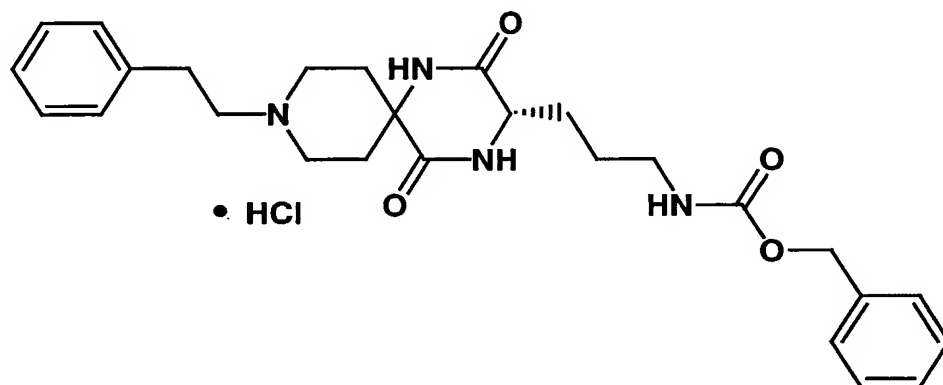


TLC : R_f 0.42 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.03 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.13-4.00 (m, 1H), 4.09 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.75-3.62 (m, 1H), 3.62-3.39 (m, 3H), 3.49 (dd, J = 10.5, 1.5 Hz, 1H), 3.26-3.12 (m, 1H), 2.95 (s, 3H), 2.56-2.37 (m, 2H), 2.37-2.20 (m, 1H), 2.20-2.10 (m, 1H), 1.82-1.63 (m, 2H), 1.50-1.30 (m, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 6 4

- 10 (3S) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - ベンジルオキシカルボニルアミノ
プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン・塩酸塩



- 参考例 2 で合成した樹脂 (3)、N - (2 - フェニルエチル) - 4 - ピペ
リドン、2, 4, 6 - トリメトキシベンジルアミンおよび N^α - (t - ブチル
オキシカルボニル) - N^δ - (ベンジルオキシカルボニル) - L - オルニチン
を用いて、参考例 9 → 参考例 10 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性
値を有する本発明化合物を得た。

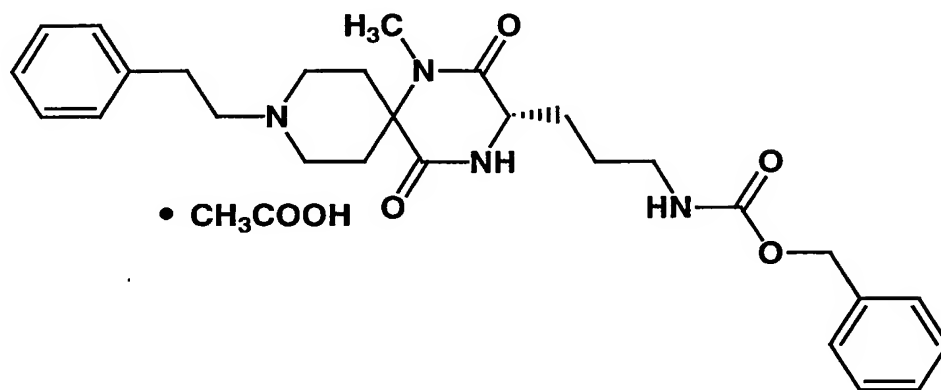
TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 20 NMR (DMSO-d₆) : δ 10.80 - 10.00 (m, 1H), 8.65 - 8.45 (m, 1H), 8.33 (s, 1H),

7.50 - 7.20 (m, 10H), 5.01 (s, 2H), 4.01 (m, 1H), 3.70 - 3.45 (m, 3H), 3.45 - 3.20 (m, 3H), 3.15 - 2.90 (m, 4H), 2.50 - 2.30 (m, 2H), 2.10 - 1.90 (m, 1H), 1.87 - 1.60 (m, 3H), 1.60 - 1.35 (m, 2H)。

5 実施例 6 5

(3S) - 1 - メチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - ベンジルオキシカルボニルアミノプロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・酢酸塩



- 10 参考例 2 で合成した樹脂 (3)、N - (2 - フェニルエチル) - 4 - ピペリドン、メチルアミンおよび N^α - (t - ブチルオキシカルボニル) - N^δ - (ベンジルオキシカルボニル) - L - オルニチンを用いて、実施例 1 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 15 MS (ESI, Pos., 40 V) : 493 (M + H)⁺ ;

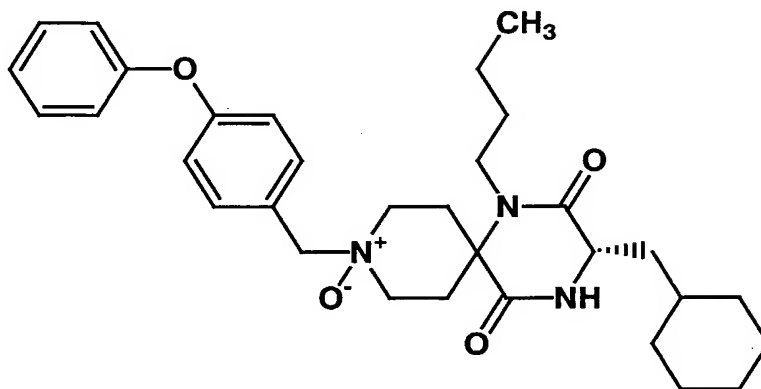
HPLC 条件 : F ;

HPLC 保持時間 : 3.36 分。

実施例 6 6

- 20 (3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9

ー（４－フェニルオキシフェニルメチル）－９－オキシド－１，４，９－トリ
 アザスピロ〔５．５〕ウンデカン



実施例４０（９０）で製造した化合物（１０４ｍｇ）のアセトン（４ｍｌ）
 5 溶液に、水（１ｍｌ）、炭酸水素ナトリウム（２１０ｍｇ）、オキシソ（６
 １５ｍｇ）（商品名）を加えた。反応混合物を室温で１時間攪拌した。反応
 混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和塩化ナ
 トリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮した。残渣
 を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール＝３０：１、
 10 ２０：１）によって精製し、以下の物性値を有する本発明化合物（７３ｍｇ）
 を得た。

TLC：R_f 0.50（クロロホルム：メタノール＝９：１）；

NMR（CDCl₃）：δ 7.49（dt，J＝8.7，2.1 Hz，2H），7.36（ddt，J＝8.7，7.2，2.1 Hz，
 2H），7.14（tt，J＝7.2，1.2 Hz，1H），7.04（dq，J＝8.7，1.2 Hz，2H），7.01（dt，J＝8.7，
 15 2.1 Hz，2H），5.82（brs，1H），4.32（s，2H），4.07-3.85（m，3H），3.55-3.46（m，2H），
 3.19-2.97（m，4H），2.02-1.49（m，11H），1.48-1.12（m，6H），1.08-0.90（m，2H），
 0.90（t，J＝7.2 Hz，3H）。

実施例６７（Ｈ３２－１）～６７（Ｈ３４－１５）

20 参考例２で製造した樹脂（３）、相当する４－ピペリドン誘導体、相当す

るアミン誘導体、相当するアミノ酸誘導体、および相当するアルデヒド誘導体を用いて、実施例 2 3 と同様の操作をし、以下の表 3 2 A - 1 ~ 3 4 A - 2 に化合物名を示し、表 3 2 B - 1 ~ 3 4 B - 3 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 3 2 C - 1 ~ 3 4 C - 1 に示した。

表32A-1

実施例番号	化合物名
67 (H32-1)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-2)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-3)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-4)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-5)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-6)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-7)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-8)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-9)	1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表32A-2

実施例番号	化合物名
67 (H32-10)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-11)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-12)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-13)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-14)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-15)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-16)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-17)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H32-18)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表32A-3

実施例番号	化合物名
67 (H32-19)	(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - メトキシベンジル) - 9 - シクロヘキシルメチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-20)	(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - メトキシベンジル) - 9 - (2 - メチルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-21)	(3 R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - メトキシベンジル) - 9 - シクロヘキシルメチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-22)	(3 R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - メトキシベンジル) - 9 - (2 - メチルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-23)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - (4 - クロロフェニル) チオフェン - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H32-24)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - (4 - メトキシフェニル) チオフェン - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表33A-1

実施例番号	化合物名
67 (H33-1)	1-(2-クロロフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-2)	1-(2-フルオロフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-3)	1-(2-トリフルオロメチルフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-4)	1-シクロプロピルメチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-5)	1-(2,2-ジメチルプロピル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-6)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-7)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-8)	1-((2E)-2-ブテニル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表33A-2

実施例番号	化合物名
67 (H33-9)	1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-エチルチオフエン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-10)	1-(2-フェニルオキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-11)	1-(チオフエン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-12)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-13)	1-(チオフエン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-14)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-15)	1-(チオフエン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H33-16)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表33A-3

実施例番号	化合物名
67 (H33-17)	1 - (チオフェン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - ヒドロキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H33-18)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - ヒドロキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

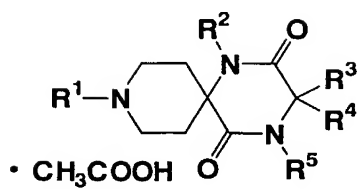
表34A-1

実施例番号	化合物名
67 (H34-1)	(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H34-2)	(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H34-3)	(3S)-1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H34-4)	(3S)-1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H34-5)	(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(シクロヘキシルメチルオキシメチル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H34-6)	(3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(シクロヘキシルメチルオキシメチル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
67 (H34-7)	(3S)-1-(2-メトキシエチル)-2,5-ジオキソ-3-(シクロヘキシルメチルオキシメチル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表34A-2

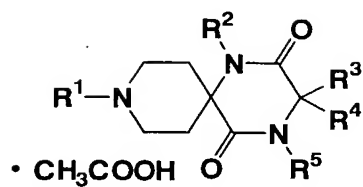
実施例番号	化合物名
67 (H34-8)	(3 S) - 1 - (2 - メトキシエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (シクロヘキシルメチルオキシメチル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-9)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - クロロ - 1, 3 - ベンゾジオキソラン - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-10)	1 - (2 - メトキシエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - クロロ - 1, 3 - ベンゾジオキソラン - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-11)	1 - (3 - メチル - 2 - ブテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-12)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((2 E) - 3 - フェニル - 2 - プロペニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-13)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - ((2 E) - 3 - フェニル - 2 - プロペニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-14)	1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (キノリン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
67 (H34-15)	1 - (3 - メチル - 2 - ブテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 32B-1



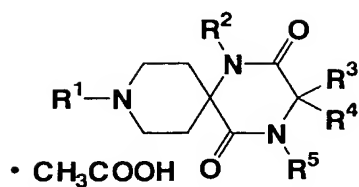
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67 (H32-1)			H		H
67 (H32-2)			H		H
67 (H32-3)			H		H
67 (H32-4)			H		H
67 (H32-5)			H		H
67 (H32-6)			H		H

表 32B-2



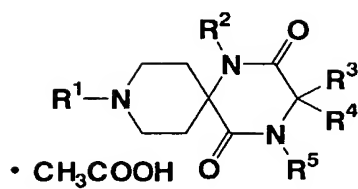
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67 (H32-7)			H		H
67 (H32-8)			H		H
67 (H32-9)			H		H
67 (H32-10)			H		H
67 (H32-11)			H		H
67 (H32-12)			H		H

表 32B-3



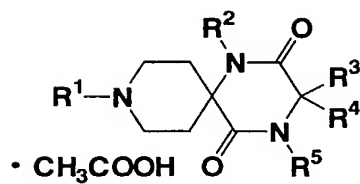
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H32-13)			H		H
67(H32-14)			H		H
67(H32-15)			H		H
67(H32-16)			H		H
67(H32-17)			H		H
67(H32-18)			H		H
67(H32-19)			H		H

表 32B-4



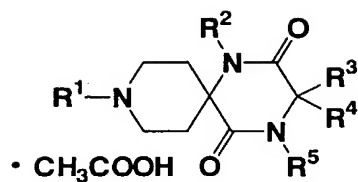
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67 (H32-20)			H		H
67 (H32-21)			H		H
67 (H32-22)			H		H
67 (H32-23)			H		H
67 (H32-24)			H		H

表 33B-1



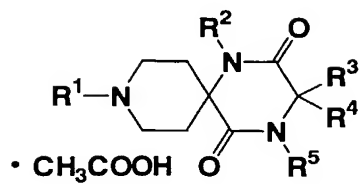
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67 (H33-1)			H		H
67 (H33-2)			H		H
67 (H33-3)			H		H
67 (H33-4)			H		H
67 (H33-5)			H		H
67 (H33-6)			H		H

表 33B-2



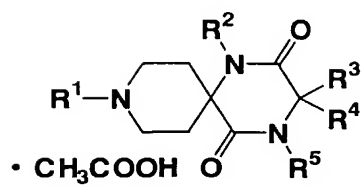
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67 (H33-7)			H		H
67 (H33-8)			H		H
67 (H33-9)			H		H
67 (H33-10)			H		H
67 (H33-11)			H		H
67 (H33-12)			H		H
67 (H33-13)			H		H

表 33B-3



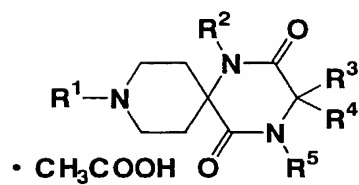
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67 (H33-14)			H		H
67 (H33-15)			H		H
67 (H33-16)			H		H
67 (H33-17)			H		H
67 (H33-18)			H		H

表 34B-1



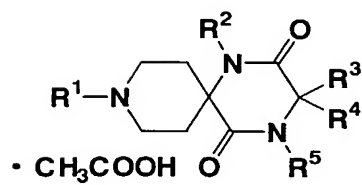
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67 (H34-1)			H		H
67 (H34-2)			H		H
67 (H34-3)			H		H
67 (H34-4)			H		H
67 (H34-5)			H		H

表 34B-2



実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67 (H34-6)			H		H
67 (H34-7)			H		H
67 (H34-8)			H		H
67 (H34-9)			H		H
67 (H34-10)			H		H
67 (H34-11)			H		H

表 34B-3



実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
67(H34-12)			H		H
67(H34-13)			H		H
67(H34-14)			H		H
67(H34-15)			H		H

表32C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
67 (H32-1)	F	3.42	450 (M + H) ⁺ , 121.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-2)	F	3.40	478 (M + H) ⁺ , 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-3)	F	3.72	512 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-4)	F	3.71	526 (M + H) ⁺ , 197.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-5)	F	3.42	514 (M + H) ⁺ , 303, 185.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-6)	F	3.31	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-7)	F	3.27	452 (M + H) ⁺ , 121.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-8)	F	3.27	480 (M + H) ⁺ , 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-9)	F	3.55	514 (M + H) ⁺ , 339, 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-10)	F	3.58	528 (M + H) ⁺ , 339, 197.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-11)	F	3.29	516 (M + H) ⁺ , 185.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-12)	F	3.12	488 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-13)	F	3.47	484 (M + H) ⁺ , 303, 121.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-14)	F	3.47	512 (M + H) ⁺ , 303, 148.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-15)	F	3.73	546 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-16)	F	3.75	560 (M + H) ⁺ , 197.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-17)	F	3.49	548 (M + H) ⁺ , 303, 185.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-18)	F	3.33	520 (M + H) ⁺ , 404.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-19)	F	3.52	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-20)	F	3.29	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-21)	F	3.49	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-22)	F	3.31	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-23)	F	3.78	502 (M + H) ⁺ , 206.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H32-24)	F	3.69	498 (M + H) ⁺ , 279, 203.	ESI (Pos., 40 V)

表33C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
67 (H33-1)	F	3.78	546 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-2)	F	3.75	530 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-3)	F	3.84	580 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-4)	F	3.66	476 (M + H) ⁺ , 339, 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-5)	F	3.80	492 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-6)	F	3.73	518 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-7)	F	3.67	502 (M + H) ⁺ , 182.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-8)	F	3.67	476 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-9)	F	3.36	422 (M + H) ⁺ , 298, 125.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-10)	F	3.80	542 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H33-11)	F	3.44	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-12)	F	3.44	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-13)	F	3.38	482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-14)	F	3.36	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-15)	F	3.26	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-16)	F	3.22	436 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-17)	F	3.20	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
67 (H33-18)	F	3.15	402 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表34C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
67 (H34-1)	F	3.71	478 (M + H) ⁺ , 279, 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-2)	F	3.42	444 (M + H) ⁺ , 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-3)	F	3.55	480 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-4)	F	3.23	446 (M + H) ⁺ , 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-5)	F	3.9	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-6)	F	3.65	514 (M + H) ⁺ , 279, 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-7)	F	3.76	550 (M + H) ⁺ , 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-8)	F	3.49	516 (M + H) ⁺ , 149.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-9)	F	3.47	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-10)	F	3.31	466 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-11)	F	3.73	490 (M + H) ⁺ , 279, 183.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-12)	F	3.55	412 (M + H) ⁺ , 117.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-13)	F	3.72	452 (M + H) ⁺ , 379, 279, 117.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-14)	F	3.44	477 (M + H) ⁺ , 404, 345.	ESI (Pos., 40 V)
67 (H34-15)	F	3.64	496 (M + H) ⁺ , 279, 149.	ESI (Pos., 40 V)

実施例 68 (H35-1) ~ 68 (H35-61)

参考例 2 で製造した樹脂 (3)、相当する 4-ピペリドン誘導体、相当するアミン誘導体、相当するアミノ酸誘導体を用いて、参考例 11 と同様の操作をし、相当するアルコール誘導体を用いて、参考例 12 → 実施例 33 と同様の操作をし、樹脂から本発明化合物を切り出し、以下の表 35A-1 ~ 35A-8 に化合物名を示し、表 35B-1 ~ 35B-13 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 35C-1 ~ 35C-3 に示した。

表35A-1

実施例番号	化合物名
68 (H35-1)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-(2-(N,N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-2)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(2-(N,N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-3)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(2-(N,N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-4)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-(2-(N,N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-5)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-(2-(N,N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-6)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(2-(N,N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-7)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(2-(N,N-ジエチルアミノ)エチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表35A-2

実施例番号	化合物名
68 (H35-8)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-9)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-10)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-11)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-12)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-13)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-14)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-15)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-エトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表35A-3

実施例番号	化合物名
68 (H35-16)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-エトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-17)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-エトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-18)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-エトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-19)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-エトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-20)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-エトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-21)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-エトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-22)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-エトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-23)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-プロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表35A-4

実施例番号	化合物名
68 (H35-24)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-25)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-26)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-27)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-28)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-29)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-プロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-30)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
68 (H35-31)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表35A-5

実施例番号	化合物名
68 (H35-32)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-33)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-34)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-35)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-36)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-37)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-イソプロピルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-38)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表35A-6

実施例番号	化合物名
68 (H35-39)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-40)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-41)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-42)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-43)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-44)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-45)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(シクロプロピルメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

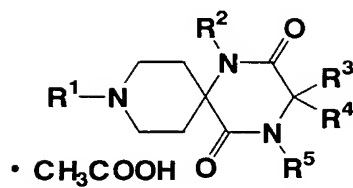
表35A-7

実施例番号	化合物名
68 (H35-46)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-シクロブチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-47)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-シクロブチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-48)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-シクロブチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-49)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-50)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-51)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-52)	1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
68 (H35-53)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表35A-8

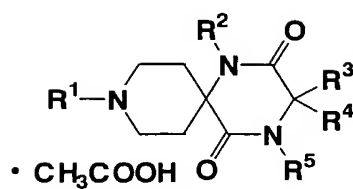
実施例番号	化合物名
68 (H35-54)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-55)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-56)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-57)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-58)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-59)	1-(チオフェン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-60)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-シクロブチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
68 (H35-61)	1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(テトラヒドロピラン-4-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 35B-1



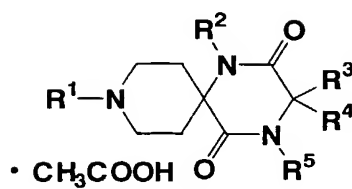
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68 (H35-1)			H		H
68 (H35-2)			H		H
68 (H35-3)			H		H
68 (H35-4)			H		H

表 35B-2



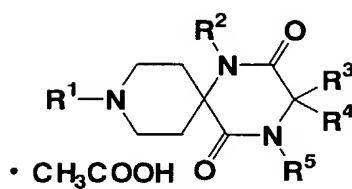
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68 (H35-5)			H		H
68 (H35-6)			H		H
68 (H35-7)			H		H
68 (H35-8)			H		H
68 (H35-9)			H		H

表 35B-3



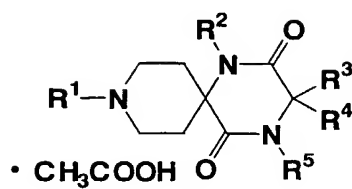
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-10)			H		H
68(H35-11)			H		H
68(H35-12)			H		H
68(H35-13)			H		H
68(H35-14)			H		H
68(H35-15)			H		H

表 35B-4



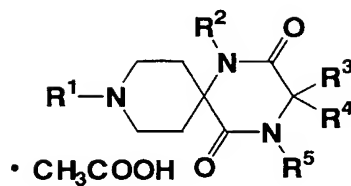
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-16)			H		H
68(H35-17)			H		H
68(H35-18)			H		H
68(H35-19)			H		H
68(H35-20)			H		H

表 35B-5



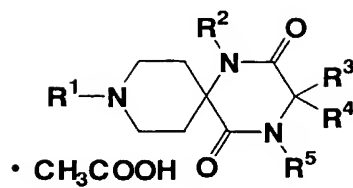
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-21)			H		H
68(H35-22)			H		H
68(H35-23)			H		H
68(H35-24)			H		H
68(H35-25)			H		H

表 35B-6



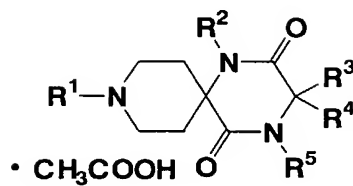
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-26)			H		H
68(H35-27)			H		H
68(H35-28)			H		H
68(H35-29)			H		H
68(H35-30)			H		H

表 35B-7



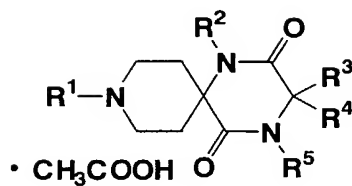
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-31)			H		H
68(H35-32)			H		H
68(H35-33)			H		H
68(H35-34)			H		H
68(H35-35)			H		H

表 35B-8



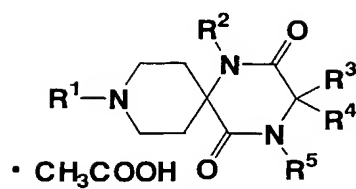
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-36)			H		H
68(H35-37)			H		H
68(H35-38)			H		H
68(H35-39)			H		H
68(H35-40)			H		H

表 35B-9



実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-41)			H		H
68(H35-42)			H		H
68(H35-43)			H		H
68(H35-44)			H		H
68(H35-45)			H		H

表 35B-10



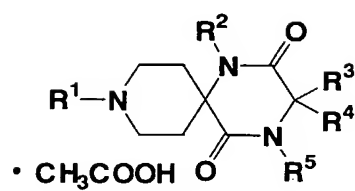
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68 (H35-46)			H		H
68 (H35-47)			H		H
68 (H35-48)			H		H
68 (H35-49)			H		H
68 (H35-50)			H		H

表 35B-11



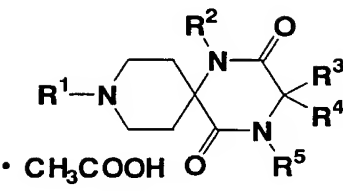
実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-51)			H		H
68(H35-52)			H		H
68(H35-53)			H		H
68(H35-54)			H		H
68(H35-55)			H		H

表 35B-12



実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68 (H35-56)			H		H
68 (H35-57)			H		H
68 (H35-58)			H		H
68 (H35-59)			H		H
68 (H35-60)			H		H

表 35B-13



実施例番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
68(H35-61)	 <chem>C1CCN(C1)Oc2ccc(CX1)cc2</chem>	 <chem>CC(C)CCX2</chem>	H	 <chem>CC(C)CCX4</chem>	H

表35C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
68 (H35-1)	F	3.31	575 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-2)	F	3.24	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-3)	F	3.22	541 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-4)	F	3.11	575 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-5)	F	3.11	534 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-6)	F	3.09	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-7)	F	3.05	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-8)	F	3.57	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-9)	F	3.57	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-10)	F	3.51	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-11)	F	3.49	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-12)	F	3.40	490 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-13)	F	3.36	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-14)	F	3.29	415 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-15)	F	3.66	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-16)	F	3.64	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-17)	F	3.58	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-18)	F	3.59	469 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-19)	F	3.47	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-20)	F	3.45	463 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-21)	F	3.40	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-22)	F	3.38	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-23)	F	3.76	558 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-24)	F	3.74	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-25)	F	3.68	524 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-26)	F	3.66	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-27)	F	3.58	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-28)	F	3.57	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表35C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
68 (H35-29)	F	3.51	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-30)	F	3.71	558 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-31)	F	3.70	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-32)	F	3.66	524 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-33)	F	3.64	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-34)	F	3.55	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-35)	F	3.52	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-36)	F	3.48	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-37)	F	3.45	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-38)	F	3.71	570 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-39)	F	3.72	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-40)	F	3.66	536 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-41)	F	3.64	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-42)	F	3.55	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-43)	F	3.53	490 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-44)	F	3.48	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-45)	F	3.47	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-46)	F	3.78	570 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-47)	F	3.77	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-48)	F	3.54	557 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-49)	F	3.81	584 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-50)	F	3.83	545 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-51)	F	3.74	550 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-52)	F	3.74	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-53)	F	3.64	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-54)	F	3.65	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-55)	F	3.57	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-56)	F	3.57	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表35C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
68 (H35-57)	F	3.53	600 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-58)	F	3.59	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-59)	F	3.42	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
68 (H35-60)	F	3.66	456 (M + H) ⁺ , 279, 161.	ESI (Pos., 40 V)
68 (H35-61)	F	3.45	486 (M + H) ⁺ , 369, 191.	ESI (Pos., 40 V)

実施例 6 9 (H 3 6 - 1) ~ 6 9 (H 3 6 - 2 4)

実施例 1 4 で製造した化合物の代わりに、相当するアミン誘導体と相当する酸クロライド誘導体を用いて、実施例 2 2 と同様の操作をし、以下の表 3 6 A - 1 ~ 3 6 A - 4 に化合物名を示し、表 3 6 B - 1 ~ 3 6 B - 5 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 3 6 C - 1 に示した。

表36A-1

実施例番号	化合物名
69 (H36-1)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((2 - フェニルフェニル) カルボニルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-2)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((3 - フェニルフェニル) カルボニルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-3)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((4 - フェニルフェニル) カルボニルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-4)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((2 - フェニルフェニル) アセチルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-5)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((3 - フェニルフェニル) アセチルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-6)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((4 - フェニルフェニル) アセチルアミノメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-7)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - (2 - フェニルフェニル) カルボニルアミノエチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表36A-2

実施例番号	化合物名
69 (H36-8)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-(3-フェニルフェニル)カルボニルアミノエチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-9)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-(4-フェニルフェニル)カルボニルアミノエチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-10)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-(2-フェニルフェニル)アセチルアミノエチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-11)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-(3-フェニルフェニル)アセチルアミノエチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-12)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-(4-フェニルフェニル)アセチルアミノエチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-13)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(3-(2-フェニルフェニル)カルボニルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-14)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(3-(3-フェニルフェニル)カルボニルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

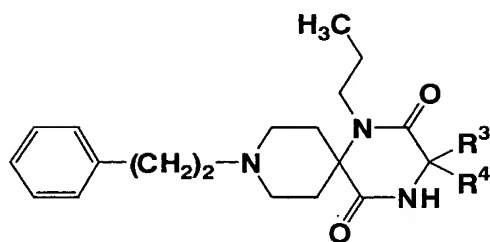
表36A-3

実施例番号	化合物名
69 (H36-15)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(3-(4-フェニルフェニル)カルボニルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-16)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(3-(2-フェニルフェニル)アセチルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-17)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(3-(3-フェニルフェニル)アセチルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-18)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(3-(4-フェニルフェニル)アセチルアミノプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-19)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-フェニルフェニル)カルボニルアミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-20)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(3-フェニルフェニル)カルボニルアミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
69 (H36-21)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-フェニルフェニル)カルボニルアミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表36A-4

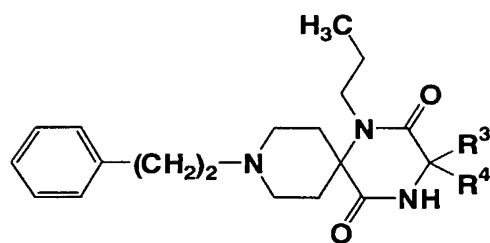
実施例番号	化合物名
69 (H36-22)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (2 - フェニルフェニル) アセチルアミノブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-23)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (3 - フェニルフェニル) アセチルアミノブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
69 (H36-24)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (4 - フェニルフェニル) アセチルアミノブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 36B-1



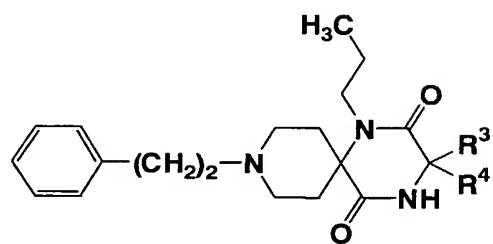
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
69(H36-1)	H		H
69(H36-2)	H		H
69(H36-3)	H		H
69(H36-4)	H		H
69(H36-5)	H		H
69(H36-6)	H		H

表 36B-2



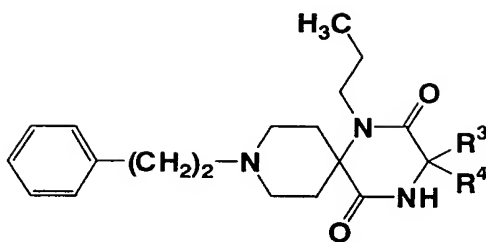
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
69 (H36-7)	H		H
69 (H36-8)	H		H
69 (H36-9)	H		H
69 (H36-10)	H		H
69 (H36-11)	H		H
69 (H36-12)	H		H
69 (H36-13)	H		H

表 36B-3



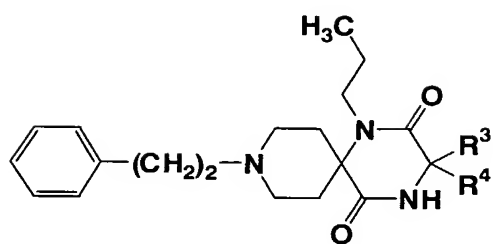
実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
69(H36-14)	H		H
69(H36-15)	H		H
69(H36-16)	H		H
69(H36-17)	H		H

表 36B-4



実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
69(H36-18)	H		H
69(H36-19)	H		H
69(H36-20)	H		H
69(H36-21)	H		H
69(H36-22)	H		H

表 36B-5



実施例番号	R ³	R ⁴	R ⁵
69(H36-23)	H		H
69(H36-24)	H		H

表36C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
69 (H36-1)	F	3.38	539 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-2)	F	3.47	539 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-3)	F	3.47	539 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-4)	F	3.45	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-5)	F	3.44	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-6)	F	3.44	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-7)	F	3.40	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-8)	F	3.49	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-9)	F	3.49	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-10)	F	3.47	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-11)	F	3.49	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-12)	F	3.49	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-13)	F	3.36	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-14)	F	3.47	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-15)	F	3.47	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-16)	F	3.45	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-17)	F	3.47	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-18)	F	3.47	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-19)	F	3.40	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-20)	F	3.49	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-21)	F	3.43	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-22)	F	3.47	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-23)	F	3.49	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
69 (H36-24)	F	3.49	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

〔製剤例〕

製剤例 1

以下の各成分を常法により混合した後打錠して、一錠中に 50 mg の活性成分を含有する錠剤 100 錠を得た。

- | | | |
|----|---|------------|
| 5 | ・ 9 - ((3 , 5 - ジメチル - 1 - フェニル) - 4 - ピラゾリル) メチル)
- 2 , 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチル - 1 - プロピル) - 1 - プロピル
- 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5 . 5] ウンデカン ・ 二塩酸塩 | -----5.0 g |
| | ・ カルボキシメチルセルロースカルシウム (崩壊剤) | -----0.2 g |
| 10 | ・ ステアリン酸マグネシウム (潤滑剤) | -----0.1 g |
| | ・ 微結晶セルロース | -----4.7 g |

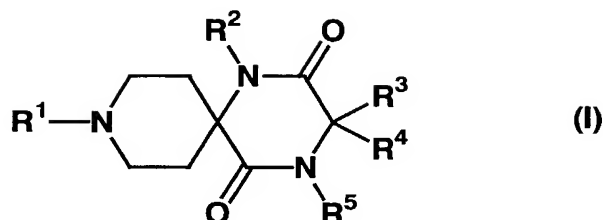
製剤例 2

以下の各成分を常法により混合した後、溶液を常法により滅菌し、5 ml ずつアンプルに充填し、常法により凍結乾燥し、1 アンプル中 20 mg の活性成分を含有するアンプル 100 本を得た。

- | | | |
|----|---|------------|
| 15 | ・ 9 - ((3 , 5 - ジメチル - 1 - フェニル) - 4 - ピラゾリル) メチル)
- 2 , 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチル - 1 - プロピル) - 1 - プロピル
- 1 , 4 , 9 - トリアザスピロ [5 . 5] ウンデカン ・ 二塩酸塩 | -----2.0 g |
| 20 | ・ マンニトール | ----- 20 g |
| | ・ 蒸留水 | -----500ml |

請 求 の 範 囲

1. 一般式 (I)



- 5 [式中、 R^1 は、
- (1) 水素原子、
 - (2) C 1 ~ 1 8 アルキル基、
 - (3) C 2 ~ 1 8 アルケニル基、
 - (4) C 2 ~ 1 8 アルキニル基、
 - 10 (5) $-\text{COR}^6$ 、
 - (6) $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ 、
 - (7) $-\text{COOR}^9$ 、
 - (8) $-\text{SO}_2\text{R}^{10}$ 、
 - (9) $-\text{COCOR}^{11}$ 、
 - 15 (10) $-\text{CONR}^{12}\text{COR}^{13}$ 、
 - (11) Cyc 1、または
 - (12) 任意に選ばれた 1 ~ 5 個の (a) ハロゲン原子、(b) $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ 、
 - (c) $-\text{COOR}^9$ 、(d) $-\text{OR}^{14}$ 、(e) $-\text{SR}^{15}$ 、(f) $-\text{NR}^{16}\text{R}^{17}$ 、(g) $-\text{NR}^{18}\text{COR}^{19}$ 、
 - (h) $-\text{SO}_2\text{NR}^{20}\text{R}^{21}$ 、(i) $-\text{OCOR}^{22}$ 、(j) $-\text{NR}^{23}\text{SO}_2$
 - 20 R^{24} 、(k) $-\text{NR}^{25}\text{COOR}^{26}$ 、(l) $-\text{NR}^{27}\text{CONR}^{28}\text{R}^{29}$ 、(m) Cyc 1、
 - (n) ケト基、(o) $-\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^{24})_2$ によって置換された C 1 ~ 1 8 アルキル基、C 2 ~ 1 8 アルケニル基、または C 2 ~ 1 8 アルキニル基を表わし、
 - (基中、 $R^6 \sim R^9$ 、 $R^{11} \sim R^{21}$ 、 R^{23} 、 R^{25} および $R^{27} \sim R^{29}$ はそれぞれ

独立して、

- (1) 水素原子、
- (2) C 1 ～ 8 アルキル基、
- (3) C 2 ～ 8 アルケニル基、
- 5 (4) C 2 ～ 8 アルキニル基、
- (5) C y c 1、または
- (6) 任意に選ばれた 1 ～ 5 個の (a) C y c 1、(b) ハロゲン原子、(c) $-OR^{30}$ 、
- (d) $-SR^{31}$ 、(e) $-NR^{32}R^{33}$ 、(f) $-COOR^{34}$ 、(g) $-CONR^{35}R^{36}$ 、
- (h) $-NR^{37}COR^{38}$ 、(i) $-NR^{39}SO_2R^{40}$ 、(j) $-N(SO_2R^{40})_2$ によ
- 10 って置換された C 1 ～ 8 アルキル基、C 2 ～ 8 アルケニル基、または C 2 ～ 8 アルキニル基を表わすか、
- R^7 と R^8 、 R^{20} と R^{21} 、 R^{28} と R^{29} は一緒になって、1) C 2 ～ 6 アルキレン基、2) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-O-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、
- 3) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-S-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、または
- 15 4) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-NR^{195}-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ を表わし (基中、 R^{195} は、水素原子、C 1 ～ 8 アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基を表わす。)、
- R^{10} 、 R^{22} 、 R^{24} および R^{26} はそれぞれ独立して、
- (1) C 1 ～ 8 アルキル基、
- 20 (2) C 2 ～ 8 アルケニル基、
- (3) C 2 ～ 8 アルキニル基、
- (4) C y c 1、または
- (5) 任意に選ばれた 1 ～ 5 個の (a) C y c 1、(b) ハロゲン原子、(c) $-OR^{30}$ 、
- (d) $-SR^{31}$ 、(e) $-NR^{32}R^{33}$ 、(f) $-COOR^{34}$ 、(g) $-CONR^{35}R^{36}$ 、
- 25 (h) $-NR^{37}COR^{38}$ 、(i) $-NR^{39}SO_2R^{40}$ 、(j) $-N(SO_2R^{40})_2$ によ
- って置換された C 1 ～ 8 アルキル基、C 2 ～ 8 アルケニル基、または C 2 ～

8 アルキニル基を表わし、

(基中、 $R^{30} \sim R^{37}$ および R^{39} はそれぞれ独立して、水素原子、C 1～8 アルキル基、C y c 1、またはC y c 1によって置換されたC 1～8 アルキル基を表わすか、

- 5 R^{35} と R^{36} は一緒になって、1) C 2～6 アルキレン基、2) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-O-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、3) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-S-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、または4) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-NR^{196}-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ を表わし(基中、 R^{196} は、水素原子、C 1～8 アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換されたC 1～8 アルキル基を表わす。)、
- 10 R^{38} および R^{40} はそれぞれ独立して、C 1～8 アルキル基、C y c 1、またはC y c 1によって置換されたC 1～8 アルキル基を表わす。)

C y c 1は、C 3～15の単環、二環、または三環式(縮合またはスピロ)炭素環、または1～4個の窒素原子、1～3個の酸素原子および/または1

- 15 ～3個の硫黄原子を含む3～15員の単環、二環、または三環式(縮合またはスピロ)複素環を表わす。

ただし、C y c 1は1～5個の R^{51} によって置換されていてもよく、

R^{51} は、

- (1) C 1～8 アルキル基、
- 20 (2) C 2～8 アルケニル基、
- (3) C 2～8 アルキニル基、
- (4) ハロゲン原子、
- (5) ニトロ基、
- (6) トリフルオロメチル基、
- 25 (7) トリフルオロメトキシ基、
- (8) ニトリル基、

- (9) ケト基、
 (10) C y c 2
 (11) $-OR^{52}$ 、
 (12) $-SR^{53}$ 、
 5 (13) $-NR^{54}R^{55}$ 、
 (14) $-COOR^{56}$ 、
 (15) $-CONR^{57}R^{58}$ 、
 (16) $-NR^{59}COR^{60}$ 、
 (17) $-SO_2NR^{61}R^{62}$ 、
 10 (18) $-OCOR^{63}$ 、
 (19) $-NR^{64}SO_2R^{65}$ 、
 (20) $-NR^{66}COOR^{67}$ 、
 (21) $-NR^{68}CONR^{69}R^{70}$ 、
 (22) $-B(OR^{71})_2$ 、
 15 (23) $-SO_2R^{72}$ 、
 (24) $-N(SO_2R^{72})_2$ 、または
 (25) 任意に選ばれた 1～5 個の (a) ハロゲン原子、(b) C y c 2、(c) $-OR^{52}$ 、
 2、(d) $-SR^{53}$ 、(e) $-NR^{54}R^{55}$ 、(f) $-COOR^{56}$ 、(g) $-CONR^{57}R^{58}$ 、
 (h) $-NR^{59}COR^{60}$ 、(i) $-SO_2NR^{61}R^{62}$ 、(j) $-OCOR^{63}$ 、(k)
 20 $-NR^{64}SO_2R^{65}$ 、(l) $-NR^{66}COOR^{67}$ 、(m) $-NR^{68}CONR^{69}R^{70}$ 、
 (n) $-B(OR^{71})_2$ 、(o) $-SO_2R^{72}$ 、(p) $-N(SO_2R^{72})_2$ によっ
 て置換された C 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、C 2～8 アルキ
 ニル基を表わす。)
- (基中、 $R^{52} \sim R^{62}$ 、 R^{64} 、 R^{66} および $R^{68} \sim R^{71}$ はそれぞれ独立して、
 25 1) 水素原子、2) C 1～8 アルキル基、3) C 2～8 アルケニル基、4) C 2～8
 アルキニル基、5) C y c 2、または 6) C y c 2、 $-OR^{73}$ 、 $-COOR^{74}$ 、

—NR⁷⁵R⁷⁶によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わすか、

R⁵⁷とR⁵⁸、R⁶¹とR⁶²、R⁶⁹とR⁷⁰は一緒になって、1) C 2～6アルキレン基、2) —(C 2～6アルキレン基)—O—(C 2～6アルキレン基)—、
 5 3) —(C 2～6アルキレン基)—S—(C 2～6アルキレン基)—、または
 4) —(C 2～6アルキレン基)—NR¹⁹⁷—(C 2～6アルキレン基)—を表わし(基中、R¹⁹⁷は、水素原子、C 1～8アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換されたC 1～8アルキル基を表わす。)、

R⁶³、R⁶⁵、R⁶⁷およびR⁷²はそれぞれ独立して、1) C 1～8アルキル基、
 10 2) C 2～8アルケニル基、3) C 2～8アルキニル基、4) Cyc 2、または5)
 Cyc 2、—OR⁷³、—COOR⁷⁴、—NR⁷⁵R⁷⁶によって置換されたC 1
 ～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わし、
 (基中、R⁷³～R⁷⁶はそれぞれ独立して、水素原子、C 1～8アルキル基、
 Cyc 2、またはCyc 2によって置換されたC 1～8アルキル基を表わ
 15 す。)

Cyc 2はCyc 1と同じ意味を表わす。

ただし、Cyc 2は1～5個のR⁷⁷によって置換されていてもよく、

R⁷⁷は、

- 1) C 1～8アルキル基、
- 20 2) ハロゲン原子、
- 3) ニトロ基、
- 4) トリフルオロメチル基、
- 5) トリフルオロメトキシ基、
- 6) ニトリル基、
- 25 7) —OR⁷⁸、
- 8) —NR⁷⁹R⁸⁰、

- 9) $-\text{COOR}^{81}$ 、
 10) $-\text{SR}^{82}$ 、
 11) $-\text{CONR}^{83}\text{R}^{84}$ 、
 12) C 2～8 アルケニル基、
 5 13) C 2～8 アルキニル基、
 14) ケト基、
 15) C y c 6、
 16) $-\text{NR}^{161}\text{COR}^{162}$ 、
 17) $-\text{SO}_2\text{NR}^{163}\text{R}^{164}$ 、
 10 18) $-\text{OCOR}^{165}$ 、
 19) $-\text{NR}^{166}\text{SO}_2\text{R}^{167}$ 、
 20) $-\text{NR}^{168}\text{COOR}^{169}$ 、
 21) $-\text{NR}^{170}\text{CONR}^{171}\text{R}^{172}$ 、
 22) $-\text{SO}_2\text{R}^{173}$ 、
 15 23) $-\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^{167})_2$ 、
 24) 任意に選ばれた 1～5 個の (a) ハロゲン原子、(b) $-\text{OR}^{78}$ 、(c) $-\text{NR}^{79}$
 R^{80} 、(d) $-\text{COOR}^{81}$ 、(e) $-\text{SR}^{82}$ 、(f) $-\text{CONR}^{83}\text{R}^{84}$ 、(g) ケト基、
 (h) C y c 6、(i) $-\text{NR}^{161}\text{COR}^{162}$ 、(j) $-\text{SO}_2\text{NR}^{163}\text{R}^{164}$ 、(k) $-\text{O}$
 COR^{165} 、(l) $-\text{NR}^{166}\text{SO}_2\text{R}^{167}$ 、(m) $-\text{NR}^{168}\text{COOR}^{169}$ 、(n) $-\text{NR}^{170}\text{CONR}^{171}\text{R}^{172}$ 、(o) $-\text{SO}_2\text{R}^{173}$ 、(p) $-\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^{167})_2$ に
 20 よって置換された C 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、C 2～8 ア
 ルキニル基を表わす。)
- (基中、 $\text{R}^{78}\sim\text{R}^{84}$ 、 $\text{R}^{161}\sim\text{R}^{164}$ 、 R^{166} 、 R^{168} および $\text{R}^{170}\sim\text{R}^{172}$
 はそれぞれ独立して、(a) 水素原子、(b) C 1～8 アルキル基、(c) C 2～8 ア
 25 ルケニル基、(d) C 2～8 アルキニル基、(e) C y c 6、(f) C y c 6、 $-\text{OR}^{174}$ 、 $-\text{COOR}^{175}$ 、 $-\text{NR}^{176}\text{R}^{177}$ 、 $-\text{CONR}^{178}\text{R}^{179}$ によって置換

されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わすか、

- R⁸³とR⁸⁴、R¹⁶³とR¹⁶⁴、R¹⁷¹とR¹⁷²は一緒になって、1) C 2～6アルキレン基、2) — (C 2～6アルキレン基) — O — (C 2～6アルキレン基) —、
 5 —、3) — (C 2～6アルキレン基) — S — (C 2～6アルキレン基) —、または 4) — (C 2～6アルキレン基) — NR¹⁹⁸ — (C 2～6アルキレン基) — を表わし (基中、R¹⁹⁸は、水素原子、C 1～8アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換されたC 1～8アルキル基を表わす。)、
 R¹⁶⁵、R¹⁶⁷、R¹⁶⁹およびR¹⁷³はそれぞれ独立して、(a) C 1～8アルキル基、(b) C 2～8アルケニル基、(c) C 2～8アルキニル基、(d) C y c 6、
 10 または(e) C y c 6、— OR¹⁷⁴、— COOR¹⁷⁵、— NR¹⁷⁶R¹⁷⁷、— CO NR¹⁷⁸R¹⁷⁹によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わす。)

- (基中、R¹⁷⁴～R¹⁷⁷はそれぞれ独立して、1)水素原子、2) C 1～8アルキル基、3) C y c 6、または 4) C y c 6によって置換されたC 1～8アルキル基を表わすか、
 15

- R¹⁷⁸とR¹⁷⁹は一緒になって、1) C 2～6アルキレン基、2) — (C 2～6アルキレン基) — O — (C 2～6アルキレン基) —、3) — (C 2～6アルキレン基) — S — (C 2～6アルキレン基) —、または 4) — (C 2～6アルキレン基) — NR¹⁹⁹ — (C 2～6アルキレン基) — を表わし (基中、R¹⁹⁹は、
 20 水素原子、C 1～8アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換されたC 1～8アルキル基を表わす。)、

- C y c 6は、C 3～8の単環式炭素環または1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含む3～8員の単環式複素環を表わす。
 25

ただし、C y c 6は1～5個のR¹⁸⁰によって置換されていてもよく、

R^{180} は、

- (1) C 1 ～ 8 アルキル基、
- (2) ハロゲン原子、
- (3) ニトロ基、
- 5 (4) トリフルオロメチル基、
- (5) トリフルオロメトキシ基、
- (6) ニトリル基、
- (7) $-OR^{181}$ 、
- (8) $-NR^{182}R^{183}$ 、
- 10 (9) $-COOR^{184}$ 、
- (10) $-SR^{185}$ 、または
- (11) $-CONR^{186}R^{187}$ を表わし

(基中、 $R^{181} \sim R^{187}$ はそれぞれ独立して、1) 水素原子、2) C 1 ～ 8 アルキル基、3) フェニル基、または 4) フェニル基によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基を表わすか、

- R^{182} と R^{183} 、 R^{186} と R^{187} は一緒になって、1) C 2 ～ 6 アルキレン基、
- 2) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-O-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、3) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-S-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、または 4) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-NR^{200}-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ を表わす (基
- 20 中、 R^{200} は、水素原子、C 1 ～ 8 アルキル基、フェニル基、フェニル基によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基を表わす。))、

R^2 は、

- (1) 水素原子、
- (2) C 1 ～ 8 アルキル基、
- 25 (3) C 2 ～ 8 アルケニル基、
- (4) C 2 ～ 8 アルキニル基、

- (5) $-OR^{90}$ 、
- (6) $Cyc3$ 、または
- (7) 任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b) $-OR^{90}$ 、(c) $-SR^{91}$ 、(d) $-NR^{92}R^{93}$ 、(e) $-COOR^{94}$ 、(f) $-CONR^{95}R^{96}$ 、(g) $-NR^{97}COR^{98}$ 、(h) $-SO_2NR^{99}R^{100}$ 、(i) $-OCOR^{101}$ 、(j) $-NR^{102}SO_2R^{103}$ 、(k) $-NR^{104}COOR^{105}$ 、(l) $-NR^{106}CONR^{107}R^{108}$ 、(m) $Cyc3$ 、(n)ケト基、(o) $-N(SO_2R^{103})_2$ によって置換されたC1～8アルキル基、C2～8アルケニル基またはC2～8アルキニル基を表わし、
- 10 (基中、 $R^{90} \sim R^{100}$ 、 R^{102} 、 R^{104} および $R^{106} \sim R^{108}$ はそれぞれ独立して、1)水素原子、2)C1～8アルキル基、3)C2～8アルケニル基、4)C2～8アルキニル基、5) $Cyc3$ 、または6) $Cyc3$ によって置換されたC1～8アルキル基、C2～8アルケニル基、C2～8アルキニル基を表わすか、
- 15 R^{95} と R^{96} 、 R^{99} と R^{100} 、 R^{107} と R^{108} は一緒になって、1)C2～6アルキレン基、2) $-(C2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-O-(C2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、3) $-(C2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-S-(C2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、または4) $-(C2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-NR^{201}-(C2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ を表わし(基中、 R^{201} は、水素原子、C1～8アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換されたC1～8アルキル基を表わす。)、
- 20 R^{101} 、 R^{103} および R^{105} はそれぞれ独立して、1)C1～8アルキル基、2)C2～8アルケニル基、3)C2～8アルキニル基、または4) $Cyc3$ または $Cyc3$ によって置換されたC1～8アルキル基、C2～8アルケニル基、C2～8アルキニル基を表わし、
- 25 $Cyc3$ は $Cyc1$ と同じ意味を表わす。
- ただし、 $Cyc3$ は1～5個の R^{109} によって置換されていてもよく、

R^{109} は R^{51} と同じ意味を表わす。)

R^3 および R^4 はそれぞれ独立して、

- (1) 水素原子、
- (2) C 1～8アルキル基、
- 5 (3) C 2～8アルケニル基、
- (4) C 2～8アルキニル基、
- (5) $-\text{COOR}^{120}$ 、
- (6) $-\text{CONR}^{121}\text{R}^{122}$ 、
- (7) Cyc 4、または
- 10 (8) 任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b)ニトリル基、(c) Cyc 4、(d) $-\text{COOR}^{120}$ 、(e) $-\text{CONR}^{121}\text{R}^{122}$ 、(f) $-\text{OR}^{123}$ 、(g) $-\text{SR}^{124}$ 、(h) $-\text{NR}^{125}\text{R}^{126}$ 、(i) $-\text{NR}^{127}\text{COR}^{128}$ 、(j) $-\text{SO}_2\text{NR}^{129}\text{R}^{130}$ 、(k) $-\text{OCOR}^{131}$ 、(l) $-\text{NR}^{132}\text{SO}_2\text{R}^{133}$ 、(m) $-\text{NR}^{134}\text{COOR}^{135}$ 、(n) $-\text{NR}^{136}\text{CONR}^{137}\text{R}^{138}$ 、(o) $-\text{S}-\text{SR}^{139}$ 、(p) $-\text{NHC}(=\text{NH})\text{NHR}^{140}$ 、(q)ケト基、(r) $-\text{NR}^{145}\text{CONR}^{146}\text{COR}^{147}$ 、(s) $-\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^{133})_2$ によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、またはC 2～8アルキニル基を表わし、
- (基中、 $R^{120}\sim R^{130}$ 、 R^{132} 、 R^{134} 、 $R^{136}\sim R^{138}$ 、 R^{145} および R^{146} はそれぞれ独立して、1)水素原子、2)C 1～8アルキル基、3)C 2～8アルケニル基、4)C 2～8アルキニル基、5)Cyc 4、または6)Cyc 4、ハロゲン原子、 $-\text{OR}^{148}$ 、 $-\text{SR}^{149}$ 、 $-\text{COOR}^{150}$ 、または $-\text{NHCOR}^{141}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わすか、
- 20 R^{121} と R^{122} 、 R^{129} と R^{130} 、 R^{137} と R^{138} は一緒になって、1)C 2～6アルキレン基、2) $-(\text{C 2}\sim\text{6アルキレン基})-\text{O}-(\text{C 2}\sim\text{6アルキレン基})-$ 、3) $-(\text{C 2}\sim\text{6アルキレン基})-\text{S}-(\text{C 2}\sim\text{6アルキレン基})-$ 、
- 25

または4) - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - NR²⁰² - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - を表わし (基中、R²⁰²は、水素原子、C 1 ~ 8 アルキル基、フェニル基、フェニル基によって置換されたC 1 ~ 8 アルキル基を表わす。)、

R¹³¹、R¹³³、R¹³⁵、R¹³⁹およびR¹⁴⁷はそれぞれ独立して、1) C 1 ~ 8 アルキル基、2) C 2 ~ 8 アルケニル基、3) C 2 ~ 8 アルキニル基、4) C y c 4、または5) C y c 4、ハロゲン原子、-OR¹⁴⁸、-SR¹⁴⁹、-COOR¹⁵⁰、または-NHCOR¹⁴¹によって置換されたC 1 ~ 8 アルキル基、C 2 ~ 8 アルケニル基、C 2 ~ 8 アルキニル基を表わし、

R¹⁴⁰は、水素原子、-COOR¹⁴²、または-SO₂R¹⁴³を表わし、
10 (基中、R¹⁴¹ ~ R¹⁴³はそれぞれ独立して、1) C 1 ~ 8 アルキル基、2) C 2 ~ 8 アルケニル基、3) C 2 ~ 8 アルキニル基、4) C y c 4、または5) C y c 4によって置換されたC 1 ~ 8 アルキル基、C 2 ~ 8 アルケニル基、C 2 ~ 8 アルキニル基を表わし、

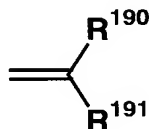
R¹⁴⁸ ~ R¹⁵⁰はそれぞれ独立して、1) 水素原子、2) C 1 ~ 8 アルキル基、3) C 2 ~ 8 アルケニル基、4) C 2 ~ 8 アルキニル基、5) C y c 4、または6) C y c 4によって置換されたC 1 ~ 8 アルキル基、C 2 ~ 8 アルケニル基、C 2 ~ 8 アルキニル基を表わし、

C y c 4はC y c 1と同じ意味を表わす。

ただし、C y c 4は1 ~ 5個のR¹⁴⁴によって置換されていてもよく、

20 R¹⁴⁴はR⁵¹と同じ意味を表わす。) を表わすか

R³とR⁴は一緒になって、



(基中、R¹⁹⁰およびR¹⁹¹はそれぞれ独立して、R³またはR⁴と同じ意味を表わす。) を表わし、

R⁵は、

- (1) 水素原子、
- (2) C¹～8アルキル基、
- (3) Cyc⁵、または

5 (4) Cyc⁵によって置換されたC¹～8アルキル基を表わす。

(基中、Cyc⁵はCyc¹と同じ意味を表わす。

ただし、Cyc⁵は1～5個のR¹⁶⁰によって置換されていてもよく、

R¹⁶⁰はR⁵¹と同じ意味を表わす。)]

で示されるトリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体、それらの四級アン

10 モニウム塩、それらのN-オキシドまたはそれらの非毒性塩。

2. 請求の範囲1に記載の一般式(I)中、R³およびR⁴が水素原子である請求の範囲1記載の化合物。

15 3. 請求の範囲1に記載の一般式(I)中、R³が水素原子、

R⁴が

- (1) C¹～8アルキル基、
- (2) C²～8アルケニル基、
- (3) C²～8アルキニル基、

20 (4) -COOR¹²⁰、

(5) -CONR¹²¹R¹²²、

(6) Cyc⁴、または

(7) 任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b)ニトリル基、(c)Cyc⁴、(d)-COOR¹²⁰、(e)-CONR¹²¹R¹²²、(f)-OR¹²³、(g)-

25 SR¹²⁴、(h)-NR¹²⁵R¹²⁶、(i)-NR¹²⁷COR¹²⁸、(j)-SO₂NR¹²⁹R¹³⁰、(k)-OCOR¹³¹、(l)-NR¹³²SO₂R¹³³、(m)-NR¹³⁴C

OOR^{135} 、 $(n) - \text{NR}^{136} \text{CONR}^{137} \text{R}^{138}$ 、 $(o) - \text{S} - \text{SR}^{139}$ 、 $(p) - \text{NHC} (= \text{NH}) \text{NHR}^{140}$ 、 (q) ケト基、 $(r) - \text{NR}^{145} \text{CONR}^{146} \text{COR}^{147}$ 、 $(s) - \text{N} (\text{SO}_2 \text{R}^{133})_2$

(すべての記号は請求の範囲 1 記載と同じ意味を表わす。) によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基、C 2 ～ 8 アルケニル基、または C 2 ～ 8 アルキニル基である請求の範囲 1 記載の化合物。

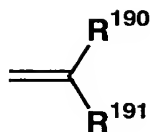
4. 請求の範囲 1 記載の一般式 (I) 中、 R^3 および R^4 がそれぞれ独立して、

- 10 (1) C 1 ～ 8 アルキル基、
- (2) C 2 ～ 8 アルケニル基、
- (3) C 2 ～ 8 アルキニル基、
- (4) $-\text{COOR}^{120}$ 、
- (5) $-\text{CONR}^{121} \text{R}^{122}$ 、
- 15 (6) Cyc 4、または
- (7) 任意に選ばれた 1 ～ 5 個の (a) ハロゲン原子、(b) ニトリル基、(c) Cyc 4、(d) $-\text{COOR}^{120}$ 、(e) $-\text{CONR}^{121} \text{R}^{122}$ 、(f) $-\text{OR}^{123}$ 、(g) $-\text{SR}^{124}$ 、(h) $-\text{NR}^{125} \text{R}^{126}$ 、(i) $-\text{NR}^{127} \text{COR}^{128}$ 、(j) $-\text{SO}_2 \text{NR}^{129} \text{R}^{130}$ 、(k) $-\text{OCOR}^{131}$ 、(l) $-\text{NR}^{132} \text{SO}_2 \text{R}^{133}$ 、(m) $-\text{NR}^{134} \text{COOR}^{135}$ 、 $(n) - \text{NR}^{136} \text{CONR}^{137} \text{R}^{138}$ 、 $(o) - \text{S} - \text{SR}^{139}$ 、 $(p) - \text{NHC} (= \text{NH}) \text{NHR}^{140}$ 、 (q) ケト基、 $(r) - \text{NR}^{145} \text{CONR}^{146} \text{COR}^{147}$ 、 $(s) - \text{N} (\text{SO}_2 \text{R}^{133})_2$
- 20

(すべての記号は請求の範囲 1 記載と同じ意味を表わす。) によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基、C 2 ～ 8 アルケニル基、または C 2 ～ 8 アルキニル基である請求の範囲 1 記載の化合物。

25

5. 請求の範囲 1 記載の一般式 (I) 中、 R^3 と R^4 が一緒になって、



(基中、すべての記号は請求の範囲 1 記載と同じ意味を表わす。) である請求の範囲 1 記載の化合物。

5

6. 化合物が

- (1) 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチル - 1 - プロピル) - 1 - プロピル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (2) 9 - (1, 4 - ペンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1 - ブチル - 3 - シクロヘキシルメチル - 2, 5 - ジオキソ - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (3) 1 - ブチル - 3 - シクロヘキシルメチル - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (2 - フェニルイミダゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ
- 15 [5. 5] ウンデカン、
- (4) 1 - ブチル - 3 - (2 - メチル - 1 - プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (5) (3 S) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6
- 20 - フェニルヘキシル) - 1 - プロピル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (6) (3 R) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1 - プロピル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (7) 1-ブチル-9-((3, 5-ジメチル-1-フェニル)-4-ピラゾ
リル)メチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-
1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (8) 1-ブチル-3-シクロヘキシルメチル-2, 5-ジオキソ-9-(4
5 -フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン、
- (9) 9-(1, 4-ベンゾジオキサ-6-イルメチル)-1-ブチル-3
-(2-メチル-1-プロピル)-2, 5-ジオキソ-1, 4, 9-トリア
ザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (10) 9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1-ブチル-2, 5-
ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1, 4, 9-トリアザスピ
ロ [5. 5] ウンデカン、
- (11) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-
(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデ
15 カン、
- (12) (3 S)-1-(2-メチルプロピル)-2, 5-ジオキソ-3-(4
-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニル
エチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (13) (3 S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベン
20 ジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (14) (3 R)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベン
ジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (15) (3 S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベン
ジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(3-フェニルプロピル)-

- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (16) (3 R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (4- (N-ベン
 ジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9- (3-フェニルプロピル) -
 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (17) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (4- (N-ベン
 ジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9- (4-フェニルブチル) - 1,
 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (18) (3 R) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (4- (N-ベン
 ジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9- (4-フェニルブチル) - 1,
 10 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (19) (3 S) - 1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロ
 ピル) - 9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (20) (3 R) - 1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロ
 ピル) - 9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (21) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (4- (N-ベン
 ジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9- (2- (2-フェニル-5-
 メチルオキサゾール-4-イル) エチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
 5] ウンデカン、
- (22) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (4- (N- (2
 20 -クロロフェニルメチル) オキシカルボニル) アミノブチル) - 9- (2-
 フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (23) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- [3- (3- (2,
 4, 6-トリメチルフェニルスルホニル) グアニジノ) プロピル] - 9- (2-
 フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (24) 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9
 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5.

- 5] ウンデカン、
- (25) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (26) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-アリルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (27) (3 S)-1-プロピル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (28) (3 R)-1-プロピル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (29) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニルメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (30) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (31) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (32) 1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (33) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-プロピル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカ

ン、

(34) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-メトキシメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

5 (35) 1-(1-メチルプロピル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(36) 1-(2-メチルブチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリ
10 アザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(37) 1-(2-メチルプロピル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(38) 1-(2-ジメチルアミノエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4,
15 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(39) 1-(2-メトキシエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

20 (40) 1-(2-メチルチオエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

(41) 1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサ-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザ
25 スピロ[5. 5]ウンデカン、

(42) 1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9

- ー（４－ベンジルオキシフェニルメチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン、
- (43) １－ベンジル－２，５－ジオキソ－３－（２－メチルプロピル）－９－（３，５－ジメチル－１－フェニルピラゾール－４－イルメチル）－１，
- 5 ４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン、
- (44) １－（３－メチルフェニルメチル）－２，５－ジオキソ－３－（２－メチルプロピル）－９－（１，４－ベンゾジオキサ－６－イルメチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン、
- (45) １－（３－メチルフェニルメチル）－２，５－ジオキソ－３－（２－
- 10 メチルプロピル）－９－（３，５－ジメチル－１－フェニルピラゾール－４－イルメチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン、
- (46) １－（１－メチルブチル）－２，５－ジオキソ－３－（２－メチルプロピル）－９－（４－フェニルオキシフェニルメチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン、
- 15 (47) １－（３－メチルブチル）－２，５－ジオキソ－３－（２－メチルプロピル）－９－（４－フェニルオキシフェニルメチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン、
- (48) １－（２－メトキシフェニルメチル）－２，５－ジオキソ－３－（２－メチルプロピル）－９－（（３，５－ジメチル－１－フェニル）－４－ピラゾリル）メチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン、
- 20 (49) １－（３－メトキシフェニルメチル）－２，５－ジオキソ－３－（２－メチルプロピル）－９－（（３，５－ジメチル－１－フェニル）－４－ピラゾリル）メチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン、
- (50) １－（２－メチルフェニルメチル）－２，５－ジオキソ－３－（２－
- 25 メチルプロピル）－９－（３，５－ジメチル－１－フェニルピラゾール－４－イルメチル）－１，４，９－トリアザスピロ〔５．５〕ウンデカン、

- (51) 1 - (3 - メチルフェニルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 -
メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4,
9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (52) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (5
5 - エチルチオフェン - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、
- (53) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (5
- エチルフラン - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン、
- 10 (54) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒ
ドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチ
ル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (55) (3 R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - ヒ
15 ドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチ
ル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (56) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベン
ジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - アリルオキシカルボニル - 1,
4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (57) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベン
20 ジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、
- (58) 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 1,
4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (59) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 1,
25 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (60) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 1, 4,

- 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (61) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベン
ジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9-(4-ジヒドロキシボランフ
ェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (62) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベン
ジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9-(1, 3-ベンゾジオキサラン
-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (63) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-
(1-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル) エチル) - 1, 4, 9-トリ
10 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (64) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-
(1-(4-フェニルオキシフェニル) エチル) - 1, 4, 9-トリアザス
ピロ [5. 5] ウンデカン、
- (65) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1
15 -(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル) エチル) - 1, 4, 9-トリア
ザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (66) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベン
ジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9-アリル-1, 4, 9-トリア
ザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (67) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-アミノブチ
ル) - 9-フェニルエチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデ
カン、
- (68) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-(4
-フェニル) フェニルカルボニル) アミノブチル) - 9-フェニルエチル-
25 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (69) ヨウ化 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル

- 9 - メチル - 9 - (1 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イル) エチル)
 - 1, 4, - ジアザ - 9 - アゾニアスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (70) (3 S) - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (2 - ヒドロキシ - 2 - フェニルエチル) -
 5 1 - プロピル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5, 5] ウンデカン、
 (71) (3 S) - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (2 - オキソ - 2 - フェニルエチル) - 1 -
 プロピル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5, 5] ウンデカン、
 (72) (3 S) - 1 - (2 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - メ
 10 チル - 9 - アリルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン、
 (73) (3 S) - 1 - (2 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - メ
 チル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
 ウンデカン、
 15 (74) (3 S) - 1 - (2 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4
 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (2 - フェニル
 エチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
 (75) (3 S) - 1 - (1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - 2, 5 - ジ
 オキソ - 3 - メチル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザ
 20 スピロ [5. 5] ウンデカン、
 (76) (3 S) - 1 - (1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - 2, 5 - ジ
 オキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9
 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデ
 カン、
 25 (77) (3 S) - 1 - (2, 2 - ジフェニルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ
 - 3 - メチル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ

[5. 5] ウンデカン、

(78) (3 S) - 1 - (2, 2-ジフェニルプロピル) - 2, 5-ジオキソ
- 3 - (4 - (N-ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (2
- フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

5 (79) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - ベンジルオ
キシフェニルメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリア
ザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(80) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジル
カルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2, 4, 6-トリメトキシベンジル)
10 - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(81) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジル
カルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2, 2-ジメチルプロピル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(82) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジル
カルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3-フェニルプロパノイル) - 1, 4,
15 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(83) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジル
カルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ベンゼンスルホニル - 1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、

20 (84) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジル
カルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ベンジルアミノカルボニル - 1, 4, 9
- トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(85) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (3-フェ
ニルプロパノイル) アミノブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4,
25 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(86) (3 S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - ベンゼンス

- ルホニルアミノブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (87) (3 S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3 - (4 - (N-ベン
ジルカルバモイル) アミノブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4,
5 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (88) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (4-メトキシフェ
ニルメチル) - 9 - シクロヘキシルメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、
- (89) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 -
10 (2 - (4-クロロフェニル) チオフェン-5-イルメチル) - 1, 4, 9
-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (90) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 -
(2 - (4-メトキシフェニル) チオフェン-5-イルメチル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (91) 1 - ((2 E) -ブテニル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチル
プロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (92) 1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メ
チルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9
20 -トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (93) 1 - (チオフェン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2
-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (94) 1-シクロプロピルメチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプ
25 ロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (95) 1 - (2 - フルオロフェニルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (96) 1 - (3 - メチル - 2 - ブテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 -
5 メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (97) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (キノリン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (98) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (ベンジルオキシカルボニルメチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (99) 1 - (3 - メチル - 2 - ブテニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1,
15 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (100) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - ((2 E) - 3 - フェニル - 2 - プロペニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (101) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1, 1 - ジメチル
20 エチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (102) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (1, 1 - ジメチルエチル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (103) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - メチルチアゾール - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ

- [5. 5] ウンデカン、
- (104) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (105) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (106) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-メチルチアゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ
- 10 [5. 5] ウンデカン、
- (107) (3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (108) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (109) (3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R)-1-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (110) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1S)-1-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (111) 1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザ
- 25 スピロ [5. 5] ウンデカン、
- (112) 1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ

- ル-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリ
アザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (113) 1-ペンチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-
(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリ
5 アザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (114) 1-(3-メトキシフェニルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(ベ
ンジルオキシメチル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール
-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (115) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
10 ル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザ
スピロ[5.5]ウンデカン、
- (116) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザ
スピロ[5.5]ウンデカン、
- 15 (117) 1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロペンチルメチル-9-(1,
4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン、
- (118) 1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(シクロヘキシルメチルオキ
シメチル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イル
20 メチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (119) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(1-メチルプロピ
ル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-
トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (120) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(1-メチルプロピ
25 ル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1,4,9-
トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

- (121) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-フェニルメチルチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (122) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-フェニルメチルチオフェン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (123) (3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 10 (124) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (125) (3R)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 15 (126) (3S)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (127) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘプチルメチル-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 20 (128) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- 25 (129) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリ

アザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(130) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

5 (131) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(3-シクロヘキシルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(132) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-ト

10 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(133) 1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(134) 1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(135) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

20 (136) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(137) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

25 (138) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4

ーメチルベンゾモルホリンー7-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピ
ロ [5. 5] ウンデカン、

(139) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-
(4-メチルベンゾモルホリンー7-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザ
5 スピロ [5. 5] ウンデカン、

(140) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-
(4-(N-メチル-N-フェニルアミノ) フェニルメチル) - 1, 4, 9
-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(141) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4
10 -(N-メチル-N-フェニルアミノ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-ト
リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(142) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-
(2-(3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル) - 5-メトキシフェニル
メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

15 (143) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2
-(3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル) - 5-メトキシフェニルメチ
ル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(144) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-
(3, 5-ジエチル-1-(4-クロロフェニル) ピラゾール-4-イルメ
20 チル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(145) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3,
5-ジエチル-1-(4-クロロフェニル) ピラゾール-4-イルメチル)
- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(146) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-
25 (6-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザ
スピロ [5. 5] ウンデカン、

- (147) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(6-フェニルオキシピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (148) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (149) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1, 3-ベンゾジオキソラン-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (150) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (151) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルチオフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (152) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(N, N-ジフェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (153) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(N, N-ジフェニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (154) (3S)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (155) (3S)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-

- イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (156) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (157) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (158) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (159) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (160) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (161) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (162) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (163) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジエチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (164) 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3,

- 5-ジエチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (165) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-フェニルチアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (166) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルチアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (167) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(1, 4-ベンゾジオキサン-2-イル)チアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (168) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-トリフルオロメチル-2-(モルホリン-1-イル)チアゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (169) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(テトラヒドロピラン-4-イルメチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (170) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(テトラヒドロピラン-4-イルメチル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (171) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-カルボキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (172) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-シクロヘキシルエチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (173) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-シクロヘキシルエチル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (174) (3R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (175) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチル-2-フェニルチアゾール-5-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (176) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(チオフェン-1-イル)チアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (177) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(ピリジン-4-イル)チアゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (178) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 4-ジメトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (179) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (180) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ピリジン-2-イル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (181) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ピリジン-3-イル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (182) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(3, 5-ジメチルピラゾール-1-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (183) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(5-クロロピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (184) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリミジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリ
- 10 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (185) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-3-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリ
- アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (186) 1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-メチルフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (187) (3R)-1-(2-ブチニル)-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (188) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-ヒドロキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリ
- 20 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (189) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-2-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザ
- 25 ピロ [5. 5] ウンデカン、
- (190) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-

- (4-(ピリジン-3-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (191) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-カルボキシフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (192) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピラジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (193) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-カルボキシフェニル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (194) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-4-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (195) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピリジン-2-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (196) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(ナフタレン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (197) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(6-メトキシナフタレン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (198) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-カルボキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

- (199) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-(ピリジン-4-イル)フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (200) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロペンチルメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (201) (3 R)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (202) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2, 2-ジメチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (203) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-ニトロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (204) (3 R)-1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (205) (3 S)-1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (206) (3 S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(3-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (207) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(カルボキシメチル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]

ウンデカン、

(208) 1-(3-ヒドロキシブチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

5 (209) 1-(3-ヒドロキシプロピル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(210) 1-(2-ヒドロキシブチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-

10 トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(211) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-アミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(212) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-
15 -(フェニルカルボニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(213) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-
-(4-メチルフェニル)スルホニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

20 (214) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(215) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウ
25 ンデカン、

(216) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-

- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(217) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-
9-(4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ
[5. 5] ウンデカン、
5 (218) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-ヒドロキシメチル-
9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル) - 1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(219) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-
(4-シクロペンチルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピ
10 ロ [5. 5] ウンデカン、
(220) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4
-(2-ジエチルアミノエチルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(221) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4
15 -(2-ジメチルアミノエチルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(222) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4
-プロピルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン、
20 (223) 1-(チオフェン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3-シク
ロヘキシルメチル-9-(4-シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル)
- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(224) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4
-シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザス
25 ピロ [5. 5] ウンデカン、
(225) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-

- (4-シクロプロピルメチルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (226) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(ジメチルアミノ)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (227) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(ジエチルアミノ)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (228) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (229) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (230) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(5-(3-メチル-4-クロロフェニル) - 1-(4-メチルフェニルメチル)ピラゾール-3-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (231) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-ジメチルアミノフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (232) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-ジエチルアミノフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (233) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-シクロヘキシルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (234) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (235) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メトキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (236) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - ブチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (237) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (2 - メチルプロピル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (238) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - フルオロフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (239) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (240) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (241) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (242) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ
- 25

[5. 5] ウンデカン、

(243) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

5 (244) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(245) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

10 (246) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - メチル - 4 - メトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(247) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (7 - メトキシ - 1, 3 - ベンゾジオキソラン - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(248) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルチオフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

20 (249) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(250) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

25 (251) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル)

- ル) - 9 - (4 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (252) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (1 - メチルエチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - ト
5 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (253) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (254) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピ
10 ル) - 9 - (4 - (2 - ヒドロキシエチルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (255) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - ヒドロキシ - 3 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (256) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - トリフルオロメチルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (257) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - メチル - 5 - クロロ - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イル
20 メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (258) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルピリジン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (259) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピ
25 ル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (260) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (261) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (5 - メチルピリジン - 2 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (262) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 1 - オキシド - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (263) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (1 - (2 - メチルプロピルオキシカルボニル) インドール - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (264) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - フェニル - 5 - メチルオキサゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (265) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (テトラヒドロピラン - 4 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (266) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (267) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (268) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(ピリジン-2-イル)ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (269) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(4-ヒドロキシフェニル)ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (270) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-(2-カルボキシエチル)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (271) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(4-(ジメチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (272) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-(5-メチルピリジン-1-オキシド-2-イルオキシ)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (273) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-(2-カルボキシ-1-エテニル)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (274) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-(4-(2-カルボキシ-1-エテニル)フェニルオキシ)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (275) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-(4-アミノカルボニルフェニルオキシ)フェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (276) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-(4-アミノスルホニルフェニルオキシ)フェニルメチル)

- ー 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(277) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-ベンジルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
5 (278) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(2, 4-ジフルオロフェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(279) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピロリジン-1-イルメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
10 (280) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-(モルホリン-4-イルスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
15 (281) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-(メチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
(282) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-シアノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
20 (283) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ジメチルアミノメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
25 (284) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-シアノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(4-(2-ジメチルアミノエチルア
ミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-
トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (285) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
5 ル) - 9 - (3-(4-ヒドロキシフェニル)フェニルメチル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (286) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) - 9 - (4-(3-メトキシフェニルオキシ)フェニルメチル) - 1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (287) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(キノキサリン-2-イル)ピラゾール
-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (288) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) - 9 - (4-フェニルカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリ
15 アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (289) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(4-(N-(2-ヒドロキシエチル)
-N-メチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)
- 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (290) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-(2-フェニルエチル)ピラゾール-
4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (291) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) - 9 - (1, 3, 5-トリメチルピラゾール-4-イルメチル) - 1,
25 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (292) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ

- ル) - 9 - (4 - (モルホリン-4-イルメチル) フェニルメチル) - 1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (293) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (4 - (4-メチルピペラジン-1-イルメチル) フェニルメチ
5 ル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、 3
- (294) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (4-フェニルスルホニルフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (295) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
10 ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1-シクロヘキシルピラゾール-4-イル
メチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (296) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (4 - (3-カルボキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (297) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (4 - (ピペリジン-1-イルメチル) フェニルメチル) - 1,
4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (298) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1 - (4 - (ピロリジン-1-イルスルホ
20 ニル) フェニル) ピラゾール-4-イルメチル) - 1, 4, 9-トリアザス
ピロ [5. 5] ウンデカン、
- (299) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルメチル) - 1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (300) (3 S) - 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピ
ル) - 9 - (3, 5-ジメチル-1 - (4 - (2-ヒドロキシエチルアミノ

スルホニル) フェニル) ピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(301) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(カルボキシメチルオキシ) フェニルメチル) -1, 4,

5 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(302) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(1-フェニル-1-ヒドロキシメチル) フェニルメチル)
-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(303) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
10 ル) -9-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル) フェニル
メチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(304) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(3-カルボキシフェニルメチルオキシ) フェニルメチル)
-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

15 (305) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(ビス(メチルスルホニル) アミノ) フェニルメチル) -
1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(306) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(4-(1, 4-ベンゾジオキサ-6-イルオキシ) フェニル
20 メチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(307) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
ル) -9-(3-(3-ヒドロキシフェニル) フェニルメチル) -1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(308) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピ
25 ル) -9-(4-(メチルスルホニルアミノ) フェニルメチル) -1, 4,
9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (309) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - (4 - メトキシフェニルオキシ) ピリジン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (310) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルアミノカルボニルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (311) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - クロロフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (312) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - (4 - カルボキシフェニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (313) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (フェニルアミノカルボニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (314) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルチオフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (315) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - (2 - ジメチルアミノエチルアミノカルボニル) フェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (316) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - アミノカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (317) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - (2 - ジメチルアミノエチルアミノカルボニル) フェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- ル) - 9 - (4 - ジメチルアミノカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9
- トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (318) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - ベンジルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
5 ウンデカン、
- (319) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (320) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (4 - (4 - メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4,
10 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (321) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (4 - (4 - メトキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4,
9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (322) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
15 ル - 9 - (2 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、
- (323) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (3 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、
- (324) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
20 ル - 9 - (4 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、
- (325) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ
ル - 9 - (3 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
25 5] ウンデカン、
- (326) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ

- ル-9-(4-シクロヘキシルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (327) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メトキシ-3-ヒドロキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (328) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-クロロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (329) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(2-メチルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (330) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3-メチルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (331) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メチルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (332) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-フェニルチオフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (333) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3-(2-メチルプロピル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、
- (334) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3-ブチルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン、

- (335) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (336) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - メトキシ - 3 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (337) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (2 - ヒドロキシエトキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (338) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2 - ヒドロキシ - 3 - メチルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (339) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (340) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (7 - メトキシ - 1, 3 - ベンゾジオキソラン - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (341) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3 - メチル - 4 - メトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (342) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - フルオロフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (343) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - トリフルオロメトキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリ

アザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(344) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3 - メチル - 5 - クロロ - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

5 (345) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2, 3 - ジメチル - 5 - オキソ - 1 - フェニルピラゾリン - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(346) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (1 - (2 - メチルプロピルオキシカルボニル) インドール - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

10 (347) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (5 - メチル - 2 - フェニルオキサゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(348) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

20 (349) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(350) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

25 (351) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 1 - オキシド - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (352) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (テトラヒドロピラン - 4 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (353) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (6 - フェニルピリジン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (354) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (355) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (ピリジン - 2 - イル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (356) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - ヒドロキシフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (357) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (2 - カルボキシエチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (358) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - ヒドロキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (359) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - カルボキシフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (360) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (ジメチルアミノスルホニル) フ

エニル) ピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(361) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(5-メチルピリジン-1-オキシド-2-イルオキシ) フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(362) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(2-カルボキシ-1-エチニル) フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(363) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(4-(1 E)-2-カルボキシ-1-エチニル) フェニルオキシ) フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(364) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(4-アミノカルボニルフェニルオキシ) フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(365) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(4-アミノスルホニルフェニルオキシ) フェニルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(366) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-ベンジルピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(367) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3, 5-ジメチル-1-(2, 4-ジフルオロフェニル) ピラゾール-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(368) (3 S) -1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル

- ル-9-(4-(ピロリジン-1-イルメチル)フェニルメチル)-1, 4,
9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (369) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-(モルホン-4-イルスルホニル)
5 フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン、
- (370) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(4-(4-シアノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4,
9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 10 (371) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-(N-(2-ヒドロキシエチル)
-N-メチルアミノスルホニル)フェニル)ピラゾール-4-イルメチル)
-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (372) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
15 ル-9-(3, 5-ジメチル-1-(2-フェニルエチル)ピラゾール-4
-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (373) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(4-(ジメチルアミノメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-
トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 20 (374) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(3-(4-ヒドロキシフェニル)フェニルメチル)-1, 4, 9
-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (375) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(3, 5-ジメチル-1-(キノキサリン-2-イル)ピラゾール
25 -4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (376) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ

- ル-9-(4-(フェニルカルボニル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリ
アザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (377) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(3, 5-ジメチル-1-(4-メチルアミノスルホニルフェニル)
5 ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウ
ンデカン、
- (378) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(1, 3, 5-トリメチルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4,
9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 10 (379) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(4-(モルホリン-4-イルメチル)フェニルメチル)-1, 4,
9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (380) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(4-(3-メトキシフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4,
15 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (381) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(4-(4-メチルピペラジン-1-イルメチル)フェニルメチル)
-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、 3
- (382) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
20 ル-9-(4-(ピリジン-1-オキシド-3-イルオキシ)フェニルメチ
ル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (383) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(4-フェニルスルホニルフェニルメチル)-1, 4, 9-トリア
ザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 25 (384) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチ
ル-9-(3, 5-ジメチル-1-シクロヘキシルピラゾール-4-イルメ

- チル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (385) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (3 - カルボキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (386) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (ピペリジン - 1 - イルメチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (387) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (ピロリジン - 1 - イルスルホニ
- 10 ル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (388) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (389) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - カルボキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (390) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (2 - ヒドロキシエチルアミノス
- 20 ルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (391) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - (2 - ジメチルアミノエチルアミノスルホニル) フェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - ト
- 25 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン、 3
- (392) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチ

- ル-9-(4-(1-ヒドロキシ-1-フェニルメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (393) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(カルボキシメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (394) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (395) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(3-カルボキシフェニルメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (396) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(1, 4-ベンゾジオキサ-6-イルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (397) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(3-(3-ヒドロキシフェニル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (398) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(メチルスルホニルアミノ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (399) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(6-(4-メトキシフェニル)ピリジン-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (400) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-(4-メチルアミノカルボニルフェニルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

- (401) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - クロロフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (402) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - ビス (メチルスルホニル) アミノフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (403) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (3 - (4 - カルボキシフェニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (404) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (フェニルアミノカルボニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (405) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - メチルチオフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (406) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (4 - (2 - ジメチルアミノエチルアミノカルボニル) フェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (407) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - アミノカルボニルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (408) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - (ジメチルアミノカルボニル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (409) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル

ル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(410) 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(411) (Z)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピリデン)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(412) (3S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒドロキシエチル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(413) (Z)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-エチリデン-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(414) (Z)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピリデン)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(415) (3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(416) (3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

(417) (3R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1R*)-1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、

- (418) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (419) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルオキシピリジン - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (420) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (421) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - シクロヘキシルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (422) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (テトラヒドロピラン - 4 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (423) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (ピリジン - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (424) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (425) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25

ピロ [5. 5] ウンデカン、

(426) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - メチル - 5 - クロロ - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.

5] ウンデカン、

(427) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - カルボキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

10 (428) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (ピリジン - 2 - イル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(429) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - カルボキシフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(430) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - ベンジルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(431) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(432) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (433) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (434) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (435) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - (6 - メチルピリジン - 3 - イルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (436) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - フルオロフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (437) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - (4 - メトキシフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (438) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - (4 - フルオロフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (439) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ
- 25

ロ [5. 5] ウンデカン、

(440) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - アリルオキシカルボニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

5 (441) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(442) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(443) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - (4 - メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(444) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(445) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(446) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (4 - (4 - メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

- (447) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 1 - シクロヘキシルメチル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサ - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (448) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (449) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチルー
- 10 1 - (4 - メチルフェニル) ピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (450) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5]
- 15 ウンデカン、
- (451) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサ - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (452) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - イソプロピルフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (453) (3 R*) - 1 - (2 - ブチニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R*) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシ
- 25 フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (454) (3 R*) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S*) - 1 -

ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリ
アザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(455) (3 R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S*)-1-
ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
5] ウンデカン、

(456) (3 R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S*)-1-
ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(4-フェニルオキシフェ
ニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(457) (3 R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S*)-1-
10 ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサ
ン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(458) (3 R*)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S*)-1-
ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル)-9-(3, 5-ジメチル-1-
フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
15 5] ウンデカン、

(459) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S)-1-ヒ
ドロキシ-2-メチルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5]
ウンデカン、

(460) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S)-1-ヒ
20 ドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニル
ピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウ
ンデカン、

(461) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S)-1-ヒ
ドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチ
25 ル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(462) (3 S)-1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-((1 S)-1-ヒ

- ドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-
イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (463) (3S)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-ヒ
ドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルスルホニルアミ
5 ノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン、
- (464) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒ
ドロキシ-2-メチルプロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]
ウンデカン、
- 10 (465) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒ
ドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニル
ピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウ
ンデカン、
- (466) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒ
15 ドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチ
ル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- (467) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒ
ドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-
イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン、
- 20 (468) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1R)-1-ヒ
ドロキシ-2-メチルプロピル)-9-(4-(4-メチルスルホニルアミ
ノフェニルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.
5]ウンデカン、
- (469) (3R)-1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-((1S)-1-ヒ
25 ドロキシ-2-メチルプロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]
ウンデカン、

- (470) (3 R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 5 (471) (3 R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (472) (3 R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 10 (473) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 15 (474) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- (475) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 20 (476) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - (4 - メチルスルホニルアミノフェニルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、
- 25 (477) (3 S) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - ベンジルオキシカルボニル

アミノプロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

(478) (3 S) - 1 - メチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - ベンジルオキシカルボニルアミノプロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9
5 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、または

(479) (3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 9 - オキシド - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン、

それらの四級アンモニウム塩、それらのN - オキシドまたはそれらの非毒性
10 塩である請求の範囲 1 記載の化合物。

7. 請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) で示されるトリアザスピロ [5. 5] ウンデカン誘導体、それらの四級アンモニウム塩、それらのN - オキシドまたはそれらの非毒性塩を有効成分として含有する医薬組成物。

15

8. 請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) で示されるトリアザスピロ [5. 5] ウンデカン誘導体、それらの四級アンモニウム塩、それらのN - オキシドまたはそれらの非毒性塩を有効成分として含有するケモカイン/ケモカイン受容体作用の制御剤。

20

9. 請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) で示されるトリアザスピロ [5. 5] ウンデカン誘導体、それらの四級アンモニウム塩、それらのN - オキシドまたはそれらの非毒性塩を有効成分として含有する喘息、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー性気管支肺アスペルギルス症、アレルギー性好酸球
25 性胃腸症、腎炎、腎症、肝炎、関節炎、慢性関節リウマチ、乾癬、鼻炎、結膜炎、虚血再灌流傷害の抑制、多発性硬化症、潰瘍性大腸炎、急性呼吸窮迫

症候群、細菌感染に伴うショック、糖尿病、自己免疫疾患の治療、移植臓器拒絶反応、免疫抑制、癌転移予防、後天性免疫不全症候群の予防および／または治療剤。

配列表

SEQUENCE LISTING

<110> ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.

<120> Triazaspiro [5.5] undecane derivatives and medicament containing the derivative as active ingredient

<130> ONF-3569PCT

<150> JP 11-344967

<151> 1999-12-03

<150> JP 2000-18673

<151> 2000-01-27

<150> JP 2000-27968

<151> 2000-02-04

<150> JP 2000-147882

<151> 2000-05-19

<160> 2

<170> PatentIn Ver. 2.1

<210> 1

<211> 37

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223> Description of Artificial Sequence:Forward primer
hCCR5XbaI

<400> 1

agctagtcta gatccgttcc cctacaagaa actctcc

37

<210> 2

<211> 37

<212> DNA

<213> Artificial Sequence

<220>

<223> Description of Artificial Sequence:Revese primer
hCCR5Xbal

<400> 2

agctagtccta gaggcacaac ctcgactgg gtcacca

37

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/08517

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D 471/10, A61K 31/499, 31/5377, A61P 29/00, 11/06, 17/00, 17/04, 37/08, 13/12, 1/16, 19/02, 29/00, 17/06, 27/16, 27/14, 9/10, 1/04, 11/00, 9/02, 3/10, 37/06, 35/04

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D 471/10, A61K 31/499, 31/5377, A61P 29/00, 11/06, 17/00, 17/04, 37/08, 13/12, 1/16, 19/02, 29/00, 17/06, 27/16, 27/14, 9/10, 1/04, 11/00, 9/02, 3/10, 37/06, 35/04

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAPLUS (STN) , CAOLD (STN) , REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO, 98/25605, A1 (MERCK & CO., INC.), 18 June, 1998 (18.06.98), Cited in the present application; Claims & US, 5962462, A	1-9
A	WO, 97/11940, A1 (ELI LILLY AND COMPANY), 03 April, 1997 (03.04.97), Cited in the present application; Claims & CA, 2233204, A & EP, 854869, A & NZ, 320963, A & JP, 11-512723, A	1-9
A	EP, 268868, A2 (SPOFA SPOJENE PODNIKY PRO ZDRAVOTNICKOU VYROBU), 01 June, 1988 (01.06.88), Full text & BE, 897843, A1 & GB, 2127807, A1 & AT, 8303366, A & SE, 8305157, A & CS, 231227 B1	1-9
A	GB, 2127807, A1 (SPOFA SPOJENE PODNIKY PRO ZDRAVOTNICKOU VYROBU), 18 April, 1984 (18.04.84),	1-9

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not
considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing
date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is
cited to establish the publication date of another citation or other
special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other
means

"P" document published prior to the international filing date but later
than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or
priority date and not in conflict with the application but cited to
understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be
considered novel or cannot be considered to involve an inventive
step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be
considered to involve an inventive step when the document is
combined with one or more other such documents, such
combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
14 February, 2001 (14.02.01)

Date of mailing of the international search report
27 February, 2001 (27.02.01)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/08517

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	<p>Full text & BE, 897843, A1 & CS, 231227, B1 & AT, 8303366, A & SE, 8305157, A & CH, 655929, A & FR, 2533919, A1 & JP, 59-89671, A2 & DE, 3335891, A1</p> <p>Blazickova, S. et al., 'Immunomodulatory characteristics of synthetic cyclic dipeptides' Int. J. Immunother. (1994), Vol.10, No.3, pp.89-93, Discussion</p>	1-9

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D 471/10, A61K 31/499, 31/5377, A61P 29/00, 11/06, 17/00, 17/04, 37/08, 13/12, 1/16, 19/02, 29/00, 17/06, 27/16, 27/14, 9/10, 1/04, 11/00, 9/02, 3/10, 37/06, 35/04

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D 471/10, A61K 31/499, 31/5377, A61P 29/00, 11/06, 17/00, 17/04, 37/08, 13/12, 1/16, 19/02, 29/00, 17/06, 27/16, 27/14, 9/10, 1/04, 11/00, 9/02, 3/10, 37/06, 35/04

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO, 98/25605, A1 (MERCK & CO., INC.), 18.6月.1998 (18.06.98), 本願で引用, 請求の範囲参照 & US, 5962462, A	1-9
A	WO, 97/11940, A1 (ELI LILY AND COMPANY), 3.4月.1997 (03.04.97), 本願で引用, 請求の範囲参照 & CA, 2233204, A & EP, 854869, A & NZ, 320963, A & JP, 11-512723, A	1-9

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献
「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

14.02.01

国際調査報告の発送日

27.02.01

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

新留 豊



4C

9639

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	EP, 268868, A2 (SPOFA SPOJENE PODNIKY PRO ZDRAVOTNICKOU VYROBU), 1.6月.1988 (01.06.88), 全文参照 & BE, 897843, A1 & GB, 2127807, A1 & AT, 8303366, A & SE, 8305157, A & CS, 231227 B1	1-9
A	GB, 2127807, A1 (SPOFA SPOJENE PODNIKY PRO ZDRAVOTNICKOU VYROBU), 18.4月.1984 (18.04.84), 全文参照 & BE, 897843, A1 & CS, 231227, B1 & AT, 8303366, A & SE, 8305157, A & CH, 655929, A & FR, 2533919, A1 & JP, 59-89671, A2 & DE, 3335891, A1	1-9
A	Blazickova, S., et al., 'Immunomodulatory characteristics of synthetic cyclic dipeptides' Int. J. Immunother. (1994), Vol.10, No.3, p.89-93, Discussion 参照	1-9